

#2

10/031698
PCT/JPGG/05260

日本国特許庁
PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

04.08.00

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: 1999年 8月 4日

REC'D 21 SEP 2000
WIPO PCI

出願番号
Application Number: 平成11年特許願第220864号

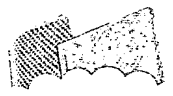
出願人
Applicant (s): 帝人株式会社

JP 00/05260

4

PRIORITY
DOCUMENT

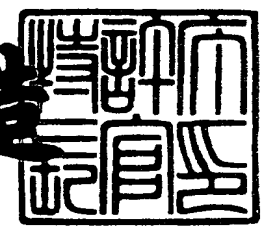
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



2000年 9月 8日

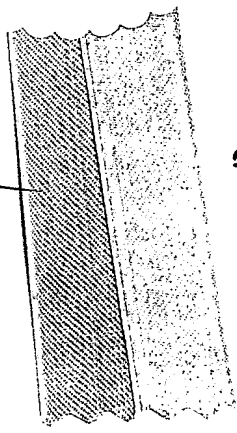
特許庁長官
Commissioner,
Patent Office

及川耕造



出証番号 出証特2000-3070981

10/031.698



【書類名】 特許願

【整理番号】 P32703

【提出日】 平成11年 8月 4日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 C07D211/58

【発明の名称】 環状アミンCCR3拮抗剤

【請求項の数】 11

【発明者】

【住所又は居所】 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内

【氏名】 塩田 辰樹

【発明者】

【住所又は居所】 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内

【氏名】 須藤 正樹

【発明者】

【住所又は居所】 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内

【氏名】 横山 朋典

【発明者】

【住所又は居所】 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内

【氏名】 室賀 由美子

【発明者】

【住所又は居所】 東京都日野市旭が丘4丁目3番2号 帝人株式会社 東京研究センター内

【氏名】 上村 孝

【特許出願人】

【識別番号】 000003001

【氏名又は名称】 帝人株式会社

【代表者】 安居 祥策

【代理人】

【識別番号】 100077263

【弁理士】

【氏名又は名称】 前田 純博

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 010250

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9701951

【ブルーフの要否】 要

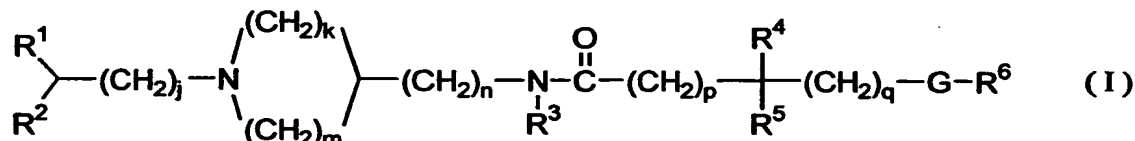
【書類名】 明細書

【発明の名称】 環状アミンCCR3拮抗剤

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式(I)

【化1】



〔式中、 R^1 はフェニル基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表わし、上記 R^1 におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^1 におけるフェニル基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、カルバモイル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルチオ基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ アルキレン基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルキレンオキシ基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_7$ アルカノイル基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_7$ アルコキカルボニル基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_7$ アルカノイルオキシ基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_7$ アルカノイルアミノ基、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $\text{C}_4 \sim \text{C}_9$ N-シクロアルキルカルバモイル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ (アルコキシカルボニル)メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式： $-\text{NH}(\text{C}=\text{O})\text{O}-$ で表わされる2価基、式： $-\text{NH}(\text{C}=\text{S})\text{O}-$ で表わされる2価基、アミノ基、モノ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)アミノ基、もしくは、ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)アミノ基で置換されてもよく、これらのフェニル基、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、ま

たは縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表わし、 R^2 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されてもよい。ただし、 $j = 0$ のときは、 R^2 はヒドロキシ基ではない。

j は0～2の整数を表わす。

k は0～2の整数を表わす。

m は2～4の整数を表わす。

n は0または1を表わす。

R^3 は、水素原子、または（それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基）によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わす。

R^4 および R^5 は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わし、 R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、（任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基）、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基、もしくは（ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形

成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは、 R^4 および R^5 は、いっしょになって3~6員環状炭化水素を形成してもよい。

p は0または1を表わす。

q は0または1を表わす。

G は、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^7-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CS}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NR}^7-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{O}-$ 、または $-\text{O}-\text{CO}-\text{NH}-$ で表わされる基を表わす。ここで、 R^7 は、水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル基を表わすか、あるいは、 R^7 は R^5 といっしょになって $\text{C}_2\sim\text{C}_5$ アルキレン基を形成してもよい。

R^6 は、フェニル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基を表わし、上記 R^6 におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^6 におけるフェニル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシ基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキル基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキルオキシ基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ アルカノイル基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ アルコキシカルボニル基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ アルカノイルオキシ基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ アルカノイルアミノ基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7\text{N}$ -アルキルカルバモイル基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、 N 、 N -ジ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)アミノ基、ジ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ (アルコキシカルボニル)アミノ基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ (アルキルスルホニル)アミノ基、もしくは、ビス($\text{C}_1\sim\text{C}_6$

アルキルスルホニル) アミノ基により置換されてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、もしくはジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。
]

で表わされる化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項2】 上記式(I)において $k = 1$ かつ $m = 2$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項3】 上記式(I)において $k = 0$ かつ $m = 3$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項4】 上記式(I)において $k = 1$ かつ $m = 3$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項5】 上記式(I)において $k = 2$ かつ $m = 2$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項6】 上記式(I)において $k = 1$ かつ $m = 4$ である、請求項1記載のCCR3拮抗作用を有する薬剤。

【請求項7】 上記式(I)で表わされる化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬。

【請求項8】 疾患がアレルギー性疾患である請求項7記載の治療薬もしくは予防薬。

【請求項9】 疾患が気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、またはアレルギー性結膜炎である請求項8記載の治療薬もしくは予防薬。

【請求項10】 疾患が炎症性腸疾患である請求項7記載の治療薬もしくは

予防薬。

【請求項 11】 疾患がエイズである請求項 7 記載の治療薬もしくは予防薬

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、潰瘍性大腸炎およびクローン病などの炎症性腸疾患、好酸球増加症、好酸球性胃腸炎、好酸球増加性腸症、好酸球性筋膜炎、好酸球性肉芽腫、好酸球性膿疱性毛包炎、好酸球性肺炎、および好酸球性白血病など、好酸球、好塩基球、活性化T細胞などの増加、組織への浸潤が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患、またはHIV（ヒト免疫不全ウイルス）の感染に起因するエイズ（AIDS：後天性免疫不全症候群）に対する治療薬および／または予防薬として効果が期待できるCCR3拮抗剤に関する。

【0002】

【従来技術】

近年、気管支喘息などのアレルギー性疾患の本質的な病態は慢性炎症であるという概念が確立され、なかでも好酸球の炎症局所への集積がその大きな特徴の一つとしてとらえられている（例えば、Busse, W.W. J. Allergy Clin. Immunol., 1998, 102, S17-S22； 藤澤隆夫, 現代医療, 1999, 31, 1297など参照）。たとえば、サルの喘息モデルにおいて抗接着分子（ICAM-1）抗体を投与することにより、好酸球の集積が抑えられ、遅発型の喘息症状発現が抑制されることからアレルギー性疾患における好酸球の重要性が強く示唆されている（Wegner, C.D. et al., Science, 1990, 247, 456）。

【0003】

この好酸球の集積／遊走を引き起こす特異的走化因子としてエオタキシンが同定された（例えば、Jose, P.J., et al., J. Exp.Med., 1994, 179, 881； Garcia-Zepeda, E.A. et al., Nature Med., 1996, 2, 449； P nath, P.D. et al.,

J. Clin. Invest., 1996, 97, 604; Kitaura, M. et al., J. Biol. Chem., 1996, 271, 7725など参照)。さらに、エオタキシンは好酸球上に発現しているCCR3レセプターに結合し作用を発現することが解明され、また、エオタキシン-2、RANTES (regulated upon activation normal T-cell expressed and secretedの略称)、MCP-2 (monocyte chemoattractant protein-2の略称)、MCP-3 (monocyte chemoattractant protein-3の略称)、MCP-4 (monocyte chemoattractant protein-4の略称)などの走化性因子もエオタキシンよりも作用強度は弱いもののCCR3を介してエオタキシンと同様の作用を示し得ることが知られている(例えば、Kitaura, M. et al., J. Biol. Chem., 1996, 271, 7725; Daugherty, B.L. et al., J. Exp. Med., 1996, 183, 2349; Ponath, P.D. et al., J. Exp. Med., 1996, 183, 2437; Hiath, H. et al., J. Clin. Invest., 1997, 99, 178; Patel, V.P. et al., J. Exp. Med., 1997, 185, 1163; Forssmann, U. et al., J. Exp. Med. 185, 2171, 1997など参照)。

【0004】

エオタキシンの好酸球への作用は、遊走惹起のみでなく、接着分子受容体(CD11b)の発現増強(例えば、Tenscher, K. et al., Blood, 1996, 88, 3195など参照)、活性酸素の産生促進(例えば、Elsner, J. et al., Eur. J. Immunol., 1996, 26, 1919など参照)、EDN (eosinophil-derived neurotoxineの略称)の放出促進(El-Shazly, et al., Int. Arch. Allergy Immunol., 1998, 117 (suppl. 1), 55参照)など、好酸球の活性化に関する作用も報告されている。また、エオタキシンは骨髄からの好酸球およびその前駆細胞の血中への遊離を促進する作用を有することも報告されている(例えば、Palframan, R. T. et al., Blood, 1998, 91, 2240など参照)。

【0005】

エオタキシンおよびCCR3が気管支喘息などのアレルギー性疾患において重要な役割を演じていることが、多くの報告により示されている。たとえば、マウス喘息モデルにおいて抗エオタキシン抗体により好酸球浸潤が抑制されること(Gonzalo, J.-A. et al., J. Clin. Invest., 1996, 98, 2332参照)、マウス皮

膚アレルギーモデルにおいて抗エオタキシン抗血清により好酸球浸潤が抑制されること (Teixeira, M.M. et al., J. Clin. Invest., 1997, 100, 1657)、マウスモデルにおいて抗エオタキシン抗体が肺肉芽腫の形成を抑制すること (Ruth, J.H. et al., J. Immunol., 1998, 161, 4276参照)、エオタキシン遺伝子欠損マウスを用いた喘息モデルおよび間質性角膜炎モデルにおいて好酸球の浸潤が抑制されること (Rothenberg, M.E. et al., J. Exp. Med., 1997, 185, 785参照)、喘息患者の気管支では健常者に比べエオタキシンおよびCCR3の発現が、遺伝子レベル、蛋白レベルともに亢進していること (Ying, S. et al., Eur. J. Immunol., 1997, 27, 3507参照)、慢性副鼻腔炎患者の鼻上皮下組織ではエオタキシンの発現が亢進していること (Am. J. Respir. Cell Mol. Biol., 1997, 17, 683参照) などが報告されている。

【0006】

また、炎症性大腸疾患である潰瘍性大腸炎およびクローン病の炎症部位において、エオタキシンが多く発現していることが報告されていることから (Garcia-Zepeda, E.A. et al., Nature Med., 1996, 2, 449参照)、これらの疾患においてもエオタキシンが重要な役割を担っていることがわかる。

【0007】

これらのデータから、エオタキシンは、CCR3を介して好酸球を病変部位に集積、活性化することにより、好酸球が病変の進展に深く関わっていると想定され得る疾患、例えば、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、潰瘍性大腸炎およびクローン病などの炎症性腸疾患、好酸球増加症、好酸球性胃腸炎、好酸球増加性腸症、好酸球性筋膜炎、好酸球性肉芽腫、好酸球性膿瘍性毛包炎、好酸球性肺炎、および好酸球性白血病などの発症、進展、維持に深く関与していることが強く示唆されている。さらに、CCR3レセプターは好酸球のみならず好塩基球、Th2リンパ球上にも発現しており、エオタキシンによりこれらの細胞の細胞内カルシウムイオン濃度上昇および細胞遊走が惹起されることが報告されていることから、エオタキシンおよびCCR3はこれらの細胞を集積させ、活性化することによってもアレルギー性疾患など、これらの細胞が関与する疾患の発

症、進展、維持に関わっていると考えられる（例えば、Sallusto, F. et al., Science, 1997, 277, 2005; Gerber, B.O. et al., Current Biol., 1997, 7, 836; Sallusto, F. et al., J. Exp. Med., 1998, 187, 875; Uguccioni, M. et al., J. Clin. Invest., 1997, 100, 1137; Yamada, H. et al., Biochem Biophys. Res. Commun., 1997, 231, 365など参照）。

【0008】

したがって、エオタキシンのCCR3に対する結合を阻害する化合物、すなわち、CCR3拮抗剤は、エオタキシンの代表されるCCR3のリガンドの標的細胞への作用を阻害することにより、アレルギー性疾患、炎症性腸疾患などの疾患の治療薬および／または予防薬として有用であるといえるが、そのような作用を有する薬剤は現在知られてない。

【0009】

また、HIV-1（ヒト免疫不全ウイルス-1）が宿主細胞に感染する際にCCR3を利用することも報告されていることから、CCR3拮抗剤はHIVウイルス感染に起因するエイズ（AIDS：後天性免疫不全症候群）の治療薬もしくは予防薬としても有用であると考えられる（例えば、et al., Choe, H. et al., Cell, 1996, 85, 1135; Doranz, B.J. et al., Cell, 1996, 85, 1149参照）。

【0010】

最近、キサンテン-9-カルボキサミド誘導体（W09804554参照）、ピペラジンまたはピペリジン誘導体（EP 903349参照）、およびその他の低分子化合物（W09802151参照）が、CCR3レセプターに対する拮抗活性を有することが報告されている。しかしながら、これらの化合物は、本発明で用いる化合物とは異なる。また、本発明で用いる化合物は、W09925686に記載されている化合物と同一のものであるが、これらの化合物がCCR3レセプターに対する拮抗活性を有することは知られていない。

【0011】

【発明が解決しようとする課題】

本発明の目的は、エオタキシンのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR

R3に結合することを阻害する活性を有する低分子化合物を提供することである。そして、CCR3拮抗剤を用いて、エオタキシンなどのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR3に結合することが病因の一つであるような疾患の治療法および／または予防法を提供することである。

【0012】

【課題を解決するための手段】

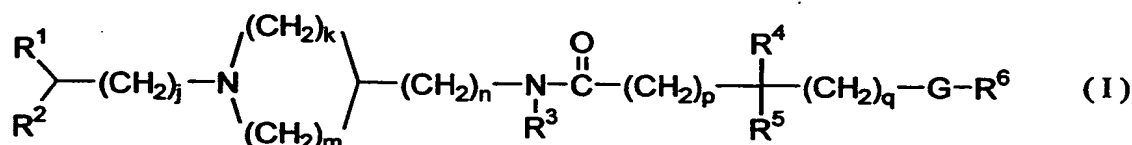
本発明者らは、鋭意研究を重ねた結果、アリアルアルキル基を有する環状アミン誘導体、その薬学的に許容し得るC₁~C₆アルキル付加体、または薬学的に許容され得る酸付加体が、エオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞に対する結合を阻害する活性を有することを発見し、さらにはそれらの化合物がCCR3が関与すると考えられる疾患の治療薬もしくは予防薬となり得ることを知見して、本発明を完成するに至った。

【0013】

すなわち、本発明によれば、下記式(I)

【0014】

【化2】



【0015】

[式中、R¹はフェニル基、C₃~C₈シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基を表わし、上記R¹におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記R¹におけるフェニル基、C₃~C₈シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₁~C₆アルキル基、C₃~C₈シクロアルキル基、C₂

$\sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_3 \sim C_5$ アルキレン基、 $C_2 \sim C_4$ アルキレンオキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_4 \sim C_9$ N-シクロアルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_3 \sim C_8$ (アルコキシカルボニル)メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式： $-NH(C=O)O-$ で表わされる2価基、式： $-NH(C=S)O-$ で表わされる2価基、アミノ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、もしくは、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基で置換されてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。

【0016】

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表わし、 R^2 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されてもよい。ただし、 $j=0$ のときは、 R^2 はヒドロキシ基ではない。

【0017】

j は0～2の整数を表わす。

【0018】

k は0～2の整数を表わす。

【0019】

m は2～4の整数を表わす。

【0020】

n は0または1を表わす。

【0021】

R^3 は、水素原子、または（それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい1または2個のフェニル基）によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わす。

【0022】

R^4 および R^5 は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わし、 R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、（任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基）、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基、もしくは（ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環）により置換されていてもよく、あるいは、 R^4 および R^5 は、いっしょになって3～6員環状炭化水素を形成してもよい。

【0023】

pは0または1を表わす。

【0024】

qは0または1を表わす。

【0025】

Gは、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^7-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CS}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NR}^7-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{O}-$ 、または $-\text{O}-\text{CO}-\text{NH}-$ で表わされる基

を表わす。ここで、 R^7 は、水素原子または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わすか、あるいは、 R^7 は R^5 といっしょになって $C_2 \sim C_5$ アルキレン基を形成してもよい。

【0026】

R^6 は、フェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表わし、上記 R^6 におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および／または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシ基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ (アルコキシカルボニル)アミノ基、 $C_1 \sim C_6$ (アルキルスルホニル)アミノ基、もしくはビス($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル)アミノ基により置換されてもよく、これらのフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、またはジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。]

で表わされる化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3 拮抗作用を有する薬剤が提供される。

【0027】

さらに、本発明によれば、上記式(I)で表わされる化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体を有効成分とする、CCR3 が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬が提供される。

【0028】

ここに、上記式(I)で表わされる化合物は、エオタキシンなどのCCR3 レセプターのリガンドが標的細胞に結合することを阻害する活性、およびエオタキシンなどのCCR3 のリガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する活性を有する。すなわち、上記式(I)で表される化合物はCCR3 拮抗剤である。

【0029】

【発明の実施の形態】

上記式(I)において、 R^1 はフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基を表わし、上記 R^1 におけるフェニル基または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、カルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_3 \sim C_5$ アルキレン基、 $C_2 \sim C_4$ アルキレンオキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、ベンジロキシ基、ベンゾイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_4 \sim C_9$ N-シクロアルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_3 \sim C_8$ (アルコキシカルボニル

メチル基、N-フェニルカルバモイル基、ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、1-ピロリジニルカルボニル基、式： $-NH(C=O)O-$ で表わされる2価基、式： $-NH(C=S)O-$ で表わされる2価基、アミノ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、もしくはジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基で置換されてもよい。

【0030】

R^1 における「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、および、シクロオクチル基などの環状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、シクロプロピル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基などが挙げられる。

【0031】

R^1 における、「ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基」とは、例えば、チエニル、フリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、トリアジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル（フラザニル）、チアジアゾリル基などの芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、チエニル、フリル、ピロリル、イソオキサゾリル、およびピリジル基などが挙げられる。

【0032】

R^1 における「縮合環」とは、上記フェニル基または芳香族複素環基が、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1～3個有する芳香族複素環基と可能な任意の位置で縮合して形成される2環式芳香族複素環基を意味し、その好適な具体例としては、ナフチル、インドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル（ベンゾフラザニル）、およびベンゾチアジアゾリル基などが挙げられる。

【0033】

なかでも R^1 は、フェニル基、チエニル基、ピラゾリル基、イソオキサゾリル

基、ベンゾフラニル基、またはインドリル基である場合が特に好ましい。

【0034】

R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としての「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などを意味し、その好適な具体例としてはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

【0035】

R^1 の置換基としての「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」とは、例えばメチル、エチル、 n -プロピル、 n -ブチル、 n -ペンチル、 n -ヘキシル、 n -ヘプチル、 n -オクチル、イソプロピル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、*tert*-ペンチル、イソヘキシル、2-メチルペンチル、1-エチルブチル基などの $C_1 \sim C_6$ の直鎖または分枝状のアルキル基を意味し、その好適な具体例としては、メチル、エチル、プロピル、およびイソプロピル基などが挙げられる。

【0036】

R^1 の置換基としての「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基」は、前記 R^1 における「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基」の定義と同様であり、その好適な具体例も同じ基を挙げることができる。

【0037】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」とは、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-メチル-1-プロペニル、4-ペンテニル、5-ヘキセニル、4-メチル-3-ペンテニル基などの $C_2 \sim C_6$ の直鎖または分枝状のアルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、ビニル基および2-メチル-1-プロペニル基などが挙げられる。

【0038】

R^1 の置換基としての「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシ基、エトキシ基などが挙げられる。

【0039】

R^1 の置換基としての「 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基とチオ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基などが挙げられる。

【0040】

R^1 の置換基としての「 $C_3 \sim C_5$ アルキレン基」とは、例えば、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、および1-メチルトリメチレン基などの $C_3 \sim C_5$ の2価のアルキレン基を意味し、その好適な具体例としては、トリメチレン基、テトラメチレン基などが挙げられる。

【0041】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_4$ アルキレンオキシ基」とは、例えば、エチレンオキシ ($-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$)、トリメチレンオキシ ($-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$)、テトラメチレンオキシ ($-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$)、1, 1-ジメチルエチレンオキシ ($-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{O}-$) 基などの、 $C_2 \sim C_4$ の2価アルキレン基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、エチレンオキシ基、トリメチレンオキシ基などが挙げられる。

【0042】

R^1 の置換基としての「 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基」とは、例えばメチレンジオキシ ($-\text{OCH}_2\text{O}-$)、エチレンジオキシ ($-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$)、トリメチレンジオキシ ($-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$)、プロピレンジオキシ ($-\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O}-$) 基などの $C_1 \sim C_3$ の2価アルキレン基と2個のオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基などが挙げられる。

【0043】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基」とは、例えば、アセチル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、イソブチリル、3-メチルブタノイル、2-メチルブタノイル、ピバロイル、4-メチルペンタノイル、3, 3-ジメチルブタノイル、5-メチルヘキサノイル基などの $C_2 \sim C_7$ の直鎖または分枝状のアルカノイル基を意味し、その好適な具体例としては、アセチル基などが挙げられる。

【0044】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とカルボニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基などが挙げられる。

【0045】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基」とは、前記 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としてはアセチルオキシ基などが挙げられる。

【0046】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基」とは、前記 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基とアミノ基とから成る基を意味し、その好適な具体例としては、アセチルアミノ基などが挙げられる。

【0047】

R^1 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ アルキルカルバモイル基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、N-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基などが挙げられる。

【0048】

R^1 の置換基としての「 $C_4 \sim C_9$ N-シクロアルキルカルバモイル基」とは、前記 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基とカルバモイル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基などが挙げられる。

【0049】

R^1 の置換基としての「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基とスルホニル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、メチルスルホニル基などが挙げられる。

【0050】

R^1 の置換基としての「 $C_3 \sim C_8$ (アルコキシカルボニル) メチル基」とは、前記 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基とメチル基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、(メトキシカルボニル) メチル基、(エトキシカルボニル

) メチル基などが挙げられる。

【0051】

R^1 の置換基としての「モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基などが挙げられる。

【0052】

R^1 の置換基としての「ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基」とは、同一または異なった2つの前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基などが挙げられる。

【0053】

上記の中でも、 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_3 \sim C_5$ アルキレン基、 $C_2 \sim C_4$ アルキレンオキシ基、メチレンジオキシ基、フェニル基、N-フェニルカルバモイル基、アミノ基、およびジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基を特に好ましい具体例として挙げることができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、メチレンジオキシ基、およびN-フェニルカルバモイル基を挙げるができる。

【0054】

さらに、 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい。ここで、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ基を好適な具体例として挙げるができる。

【0055】

上記式 (I) において、 R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、またはフェニル基を表わし、 R^2 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはフェニル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されてもよい。ただし、 $j = 0$ のときは、 R^2 はヒドロキシ基ではない。

【0056】

R^2 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基および $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基は、 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基についてそれぞれ定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0057】

R^2 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基および $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基または縮合環の置換基について定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げるができる。

【0058】

なかでも R^2 は、水素原子を表わす場合が特に好ましい。

【0059】

上記式 (I) において、 j は0～2の整数を表わす。 j は0である場合が特に好ましい。

【0060】

上記式 (I) において、 k は0～2の整数を表わし、 m は2～4の整数を表わす。なかでも k が0で m が3である場合の2-置換ピロリジン、 k が1で m が2である場合の3-置換ピロリジン、 k が1で m が3である場合の3-置換ピペリジン、 k が2で m が2である場合の4-置換ピペリジン、または k が1で m が4である場合の3-置換ヘキサヒドロアゼピンが好ましい。特に好ましくは、 k が1で m が2である場合の3-置換ピロリジンおよび k が2で m が2である場合の4-置換ピペリジンを挙げるができる。

【0061】

上記式 (I) において、 n は 0 または 1 を表わす。

【0062】

特に、 k が 1 で m が 2 で n が 0 である場合の 3-アミドピロリジン、および k が 2 で m が 2 で n が 1 である場合の 4-(アミドメチル)ピペリジンを特に好ましい例として挙げることができる。

【0063】

上記式 (I) において、 R^3 は水素原子、または (それぞれ同一または異なった任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、もしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよい 1 または 2 個のフェニル基) によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わす。

【0064】

R^3 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、その好適な具体例としては、メチル基、エチル基、およびプロピル基が挙げられる。

【0065】

R^3 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基は、それぞれ、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0066】

なかでも、 R^3 は水素原子または無置換の $C_1 \sim C_6$ アルキル基である場合が特に好ましい。

【0067】

上記式 (I) において、 R^4 および R^5 は、同一または異なって、水素原子、ヒドロキシ基、フェニル基、または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わし、 R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基

、ニトロ基、カルボキシル基、カルバモイル基、メルカプト基、グアニジノ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、(任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、もしくはベンジルオキシ基によって置換されていてもよいフェニル基)、フェノキシ基、ベンジルオキシ基、ベンジルオキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、または(ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基またはそのベンゼン環との縮合により形成される縮合環)により置換されていてもよく、あるいは、 R^4 および R^5 は、いっしょになって3~6員環状炭化水素を形成してもよい。

【0068】

R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0069】

R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、およびジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0070】

R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基の置換基としての $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、および、ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基は、前記 R^1 において定義されたものと同

様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げる事ができる。

【0071】

R^4 および R^5 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基の置換基としてのフェニル基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基は、前記 R^1 においてフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げる事ができる。

【0072】

R^4 、 R^5 およびその隣接炭素原子とからなる「3～6員環状炭化水素」の好適な具体例としては、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、およびシクロヘキサンなどが挙げられる。なかでも、水素原子と $C_1 \sim C_6$ アルキル基を、 R^4 と R^5 の特に好ましい例として挙げる事ができる。

【0073】

上記式 (I) において、 p は0または1を表わし、 q は0または1を表わす。 p と q がともに0である場合が特に好ましい。

【0074】

上記式 (I) において、 G は、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^7$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}-\text{CS}-\text{NH}-$ 、 $-\text{NR}^7-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NR}^7-$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{O}-$ 、または $-\text{O}-\text{CO}-\text{NH}-$ で表わされる基を表わす。ここで、 R^7 は、水素原子または $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表わすか、あるいは、 R^7 は R^5 と一しょになって $C_2 \sim C_5$ アルキレン基を形成してもよい。

【0075】

ここで、 $-\text{CO}-$ はカルボニル基を、 $-\text{SO}_2-$ はスルホニル基を、 $-\text{CS}-$ はチオカルボニル基をそれぞれ意味する。 G の特に好ましい例としては、例えば $-\text{NR}^7-\text{CO}-$ および $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で表わされる基などが挙げられる。

【0076】

R^7 における $C_1 \sim C_6$ アルキル基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シ

クロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げるができる。

【0077】

R^5 と R^7 とからなる「 $C_2 \sim C_5$ アルキレン基」とは、例えば、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、ペンタメチレンなどの $C_2 \sim C_5$ の直鎖または分枝状アルキレン基を意味し、その好適な具体例としてはエチレン、トリメチレン、テトラメチレン基などが挙げられる。なかでも R^7 としては、水素原子を特に好ましい例として挙げるができる。

【0078】

上記式(I)において、 R^6 はフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基を表わし、上記 R^6 におけるフェニル基、ベンジル基、または芳香族複素環基は、ベンゼン環、またはヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基と縮合して縮合環を形成してもよく、さらに上記 R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環は、任意個のハロゲン原子、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、チオシアナト基、カルボキシ基、カルバモイル基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基、フェニル基、フェノキシ基、フェニルアミノ基、ベンジル基、ベンゾイル基、フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、3-フェニルウレイド基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルカルバモイル基、N, N-ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)スルファモイル基、アミノ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、ベンジルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ (アル

コキシカルボニル) アミノ基、 $C_1 \sim C_6$ (アルキルスルホニル) アミノ基、もしくはビス ($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル) アミノ基により置換されてもよい。

【0079】

R^6 における $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、ヘテロ原子として酸素原子、硫黄原子、および/または窒素原子を1~3個有する芳香族複素環基、および、縮合環は、前記 R^1 に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0080】

R^6 における「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基」とは、例えば、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、およびシクロオクテニル基など環状アルケニル基を意味し、その好適な具体例としては、1-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基などが挙げられる。なかでも、 R^6 としては、フェニル基、フリル基、チエニル基、インドリル基、ベンゾフラザニル基を特に好ましい例として挙げるすることができる。

【0081】

R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキレンジオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルオキシ基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、 $C_2 \sim C_7$ N-アルキルカルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基、およびジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げるすることができる。

【0082】

R^6 の置換基としての $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基は、前記 R^1 における $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基に関して定義されたものと同様であり、同じ例を好適な具体例として挙げるすることができる。

【0083】

R^6 の置換基としての「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基」とは、前記 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基とオキシ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基などを挙げる事ができる。

【0084】

R^6 の置換基としての「N, N-ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) スルファモイル基」とは、同一または異なった2つの前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されたスルファモイル基を意味し、その好適な具体例としては、例えばN, N-ジメチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基などが挙げられる。

【0085】

R^6 の置換基としての「 $C_2 \sim C_7$ (アルコキシカルボニル) アミノ基」とは、前記 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、例えば (メトキシカルボニル) アミノ基、(エトキシカルボニル) アミノ基などを挙げる事ができる。

【0086】

R^6 の置換基としての「 $C_1 \sim C_6$ (アルキルスルホニル) アミノ基」とは、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基とアミノ基とからなる基を意味し、その好適な具体例としては、(メチルスルホニル) アミノ基などを挙げる事ができる。

【0087】

R^6 の置換基としての「ビス ($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル) アミノ基」とは、同一または異なった2つの前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基によって置換されたアミノ基を意味し、その好適な具体例としては、ビス (メチルスルホニル) アミノ基などを挙げる事ができる。

【0088】

なかでも、 R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基としては、ハロゲン原子、メルカプト基、ニトロ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$

アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、フェニル基、ベンジルオキシ基、フェニルスルフィニル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイル基、 $C_2 \sim C_7$ アルカノイルアミノ基、アミノ基などを好ましい例として挙げることができる。特に好ましくは、ハロゲン原子、ニトロ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、フェニルスルフィニル基、およびアミノ基を挙げることができる。

【0089】

さらに、 R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基は、さらに任意個のハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、トリフルオロメチル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、またはジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基によって置換されていてもよい。

【0090】

R^6 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル基、ベンジル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基の置換基としてのハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、モノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、およびジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基は、前記 R^1 におけるフェニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、芳香族複素環基、または縮合環の置換基に関して定義されたものと同様であり、それぞれ同じ例を好適な具体例として挙げることができる。

【0091】

上記式(I)で表わされる化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体は、その治療有効量を製薬学的に許容される担体および／または希釈剤とともに医薬組成物とすることによって、本発明のエオタキシンなどのCCR3のリガンドが標的細胞上のCCR3に結合することを阻害する医薬、あるいはエオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞への生理的作用を阻害する作用をもつ医薬、さらにはCCR3が関与すると考えられる疾患の治療薬もしくは予防薬とすることができる。すなわち上記式(I)で表わされる環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加塩体、

またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体は、経口的に、あるいは、静脈内、皮下、筋肉内、経皮、または直腸内など非経口的に投与することができる。

【0092】

経口投与の剤形としては、例えば錠剤、丸剤、顆粒剤、散剤、液剤、懸濁剤、カプセル剤などが挙げられる。

【0093】

錠剤の形態にするには、例えば乳糖、デンプン、結晶セルロースなどの賦形剤；カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリビニルピロリドンなどの結合剤；アルギン酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどの崩壊剤などを用いて通常の方法により成形することができる。

【0094】

丸剤、散剤、顆粒剤も同様に前記の賦形剤などを用いて通常の方法によって成形することができる。液剤、懸濁剤は、例えばトリカプリリン、トリアセチンなどのグリセリンエステル類、エタノールなどのアルコール類などを用いて通常の方法によって成形される。カプセル剤は、顆粒剤、散剤、あるいは液剤などをゼラチンなどのカプセルに充填することによって成形される。

【0095】

皮下、筋肉内、静脈内投与の剤型としては、水性あるいは非水性溶液剤などの形態にある注射剤がある。水性溶液剤は、例えば生理食塩水などが用いられる。非水性溶液剤は、例えばプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、オリーブ油、オレイン酸エチルなどが用いられ、これらに必要な応じて防腐剤、安定剤などが添加される。注射剤は、バクテリア保留フィルターを通す濾過、殺菌剤の配合の処置を適宜行うことによって無菌化される。

【0096】

経皮投与の剤型としては、例えば軟膏剤、クリーム剤などが挙げられ、軟膏剤は、ヒマシ油、オリーブ油などの油脂類、またはワセリンなどを用いて、クリーム剤は、脂肪油、またはジエチレングリコールやソルビタンモノ脂肪酸エステルなどの乳化剤を用いて通常の方法によって成形される。

【0097】

直腸内投与のためには、ゼラチンソフトカプセルなどの通常の座剤が用いられる。

【0098】

本発明の環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体の投与量は、疾患の種類、投与経路、患者の年齢と性別、および疾患の程度などによって異なるが、通常成人一人当たり $1 \sim 500 \text{ mg/日}$ である。

【0099】

上記式 (I) の環状アミン誘導体の好適な具体例として、以下の Table 1. 1~1. 201 に示される各置換基を含有する化合物を挙げることができる。


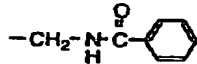

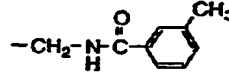

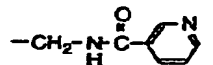
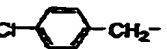
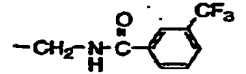
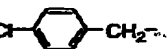
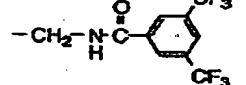
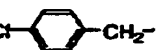
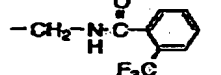
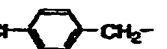
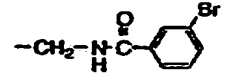
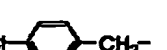
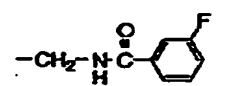
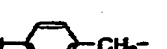
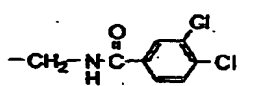

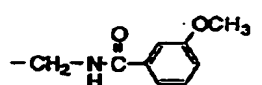
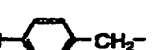
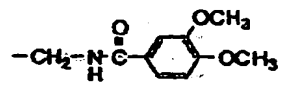
【0100】

Table 1. 1~1. 201 において、「Table」は「表」を意味し、「Compd. No.」は「化合物番号」を意味し、「chirality」は「絶対配置」を意味する。「chirality (絶対配置)」とは、環状アミンの環上の不斉炭素の絶対配置を意味する。「R」は、環状アミンの環上の不斉炭素原子が R の絶対配置を持つこと、「S」は、不斉炭素原子が S の絶対配置を持つこと、「-」はラセミ体であるか、あるいはその化合物が環状アミン上において不斉炭素原子をもたないことを意味する。

【0101】

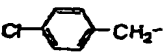
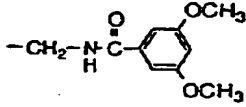
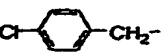
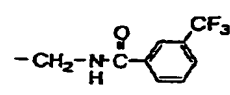
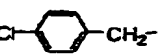
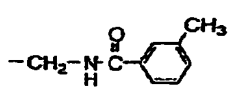
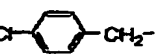
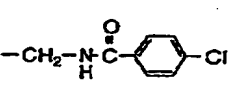
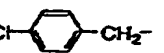
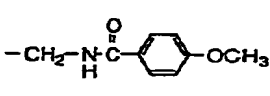
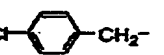
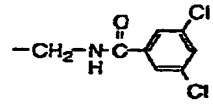
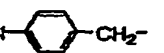
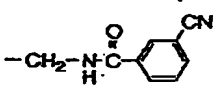
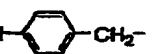
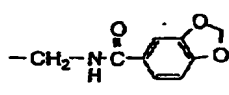
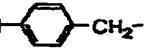
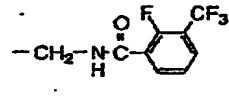
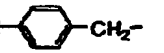
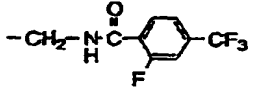
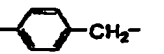
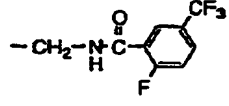
【表 1】

Table 1.1

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
1		1	2	0	-	H	
2		1	2	0	-	H	
3		1	2	0	-	H	
4		1	2	0	-	H	
5		1	2	0	S	H	
6		1	2	0	S	H	
7		1	2	0	S	H	
8		1	2	0	S	H	
9		1	2	0	S	H	
10		1	2	0	S	H	
11		1	2	0	S	H	

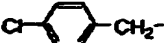
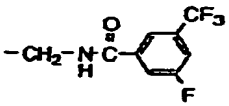

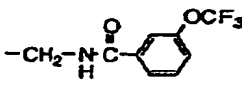

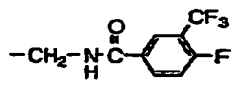

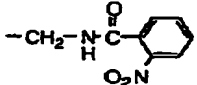

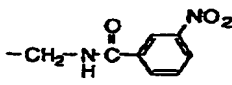

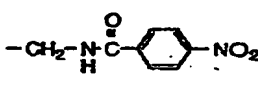

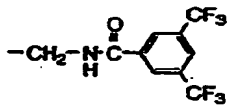
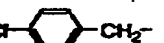
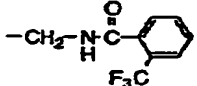
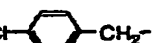
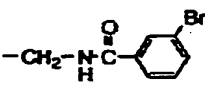
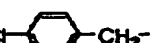
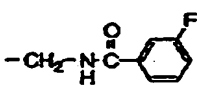
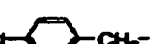
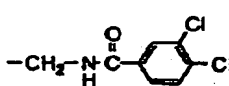
[0102]

Table 1.2

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
12		1	2	0	S	H	
13		1	2	0	S	H	
14		1	2	0	S	H	
15		1	2	0	S	H	
16		1	2	0	S	H	
17		1	2	0	S	H	
18		1	2	0	S	H	
19		1	2	0	S	H	
20		1	2	0	S	H	
21		1	2	0	S	H	
22		1	2	0	S	H	


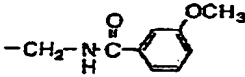
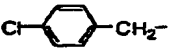
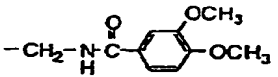
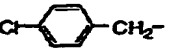
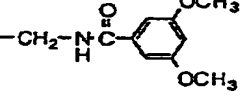
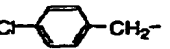
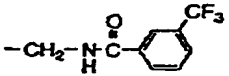
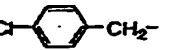
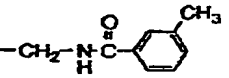
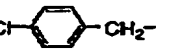
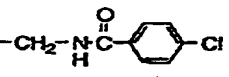
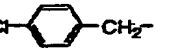
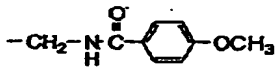
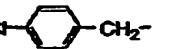
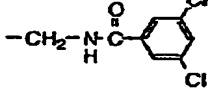
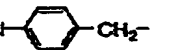
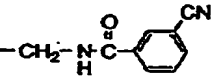
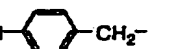
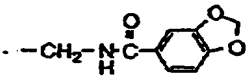

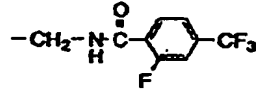
[0103]

Table 1.3

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
23		1	2	0	S	H	
24		1	2	0	S	H	
25		1	2	0	S	H	
26		1	2	0	S	H	
27		1	2	0	S	H	
28		1	2	0	S	H	
29		1	2	0	R	H	
30		1	2	0	R	H	
31		1	2	0	R	H	
32		1	2	0	R	H	
33		1	2	0	R	H	


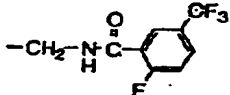

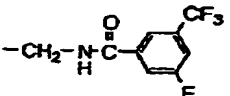

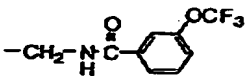

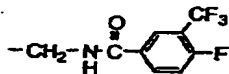
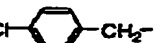
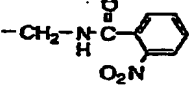
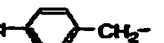
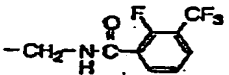
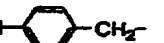
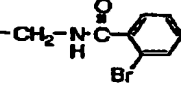

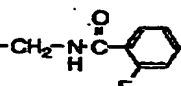
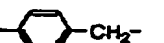
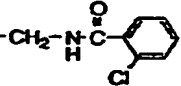

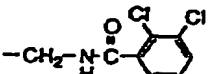
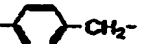
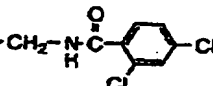
[0104]

Table 1.4

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
34		1	2	0	R	H	
35		1	2	0	R	H	
36		1	2	0	R	H	
37		1	2	0	R	H	
38		1	2	0	R	H	
39		1	2	0	R	H	
40		1	2	0	R	H	
41		1	2	0	R	H	
42		1	2	0	R	H	
43		1	2	0	R	H	
44		1	2	0	R	H	


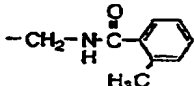
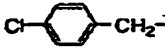
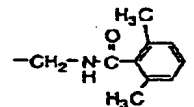

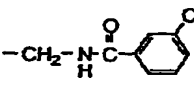

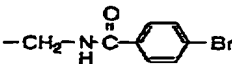
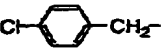
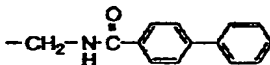
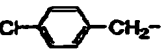
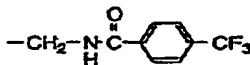

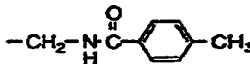

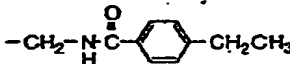
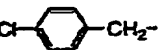
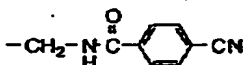

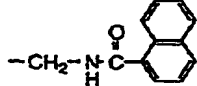
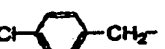
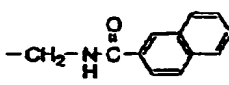
[0105]

Table 1.5

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
45		1	2	0	R	H	
46		1	2	0	R	H	
47		1	2	0	R	H	
48		1	2	0	R	H	
49		1	2	0	R	H	
50		1	2	0	R	H	
51		1	2	0	R	H	
52		1	2	0	R	H	
53		1	2	0	R	H	
54		1	2	0	R	H	
55		1	2	0	R	H	


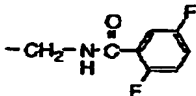

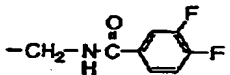

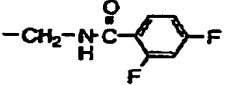
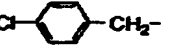
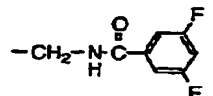
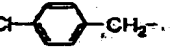
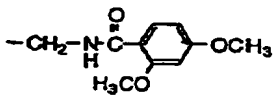
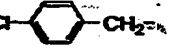
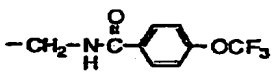
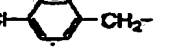
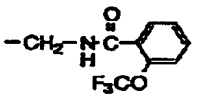
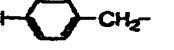
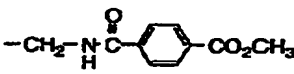
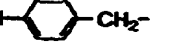
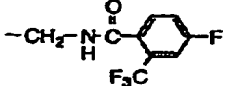
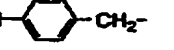
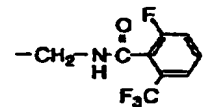

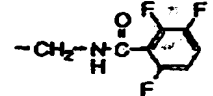
[0106]

Table 1.6

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
56		1	2	0	R	H	
57		1	2	0	R	H	
58		1	2	0	R	H	
59		1	2	0	R	H	
60		1	2	0	R	H	
61		1	2	0	R	H	
62		1	2	0	R	H	
63		1	2	0	R	H	
64		1	2	0	R	H	
65		1	2	0	R	H	
66		1	2	0	R	H	

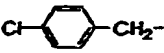
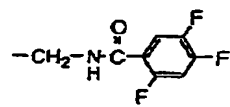

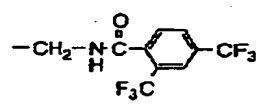
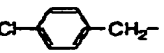
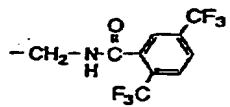

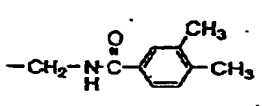
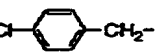
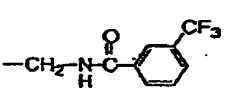
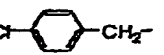
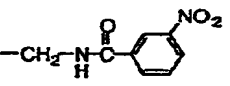
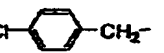
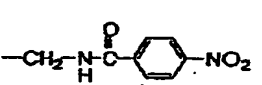
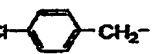
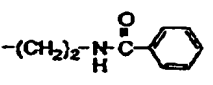
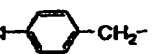
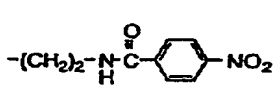
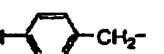
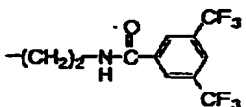
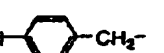
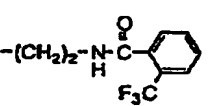
[0107]

Table 1.7

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
67		1	2	0	R	H	
68		1	2	0	R	H	
69		1	2	0	R	H	
70		1	2	0	R	H	
71		1	2	0	R	H	
72		1	2	0	R	H	
73		1	2	0	R	H	
74		1	2	0	R	H	
75		1	2	0	R	H	
76		1	2	0	R	H	
77		1	2	0	R	H	

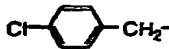
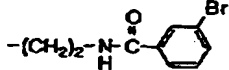

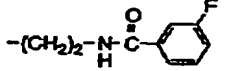
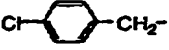
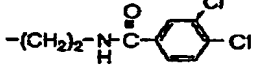
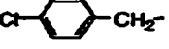
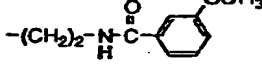

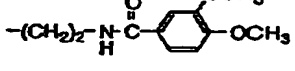
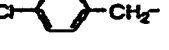
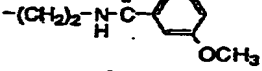
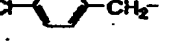
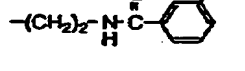

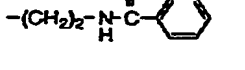

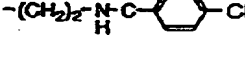



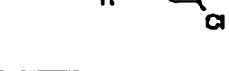
[0108]

Table 1.8

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
78		1	2	0	R	H	
79		1	2	0	R	H	
80		1	2	0	R	H	
81		1	2	0	R	H	
82		1	2	0	-	-CH ₃	
83		1	2	0	R	H	
84		1	2	0	R	H	
85		1	2	0	-	H	
86		1	2	0	-	H	
87		1	2	0	S	H	
88		1	2	0	S	H	

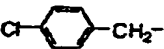
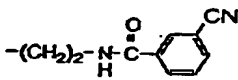

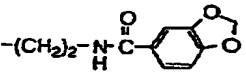

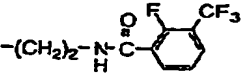
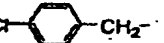
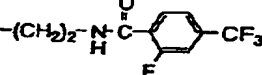
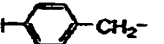
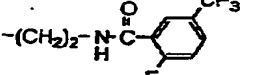
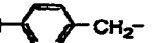
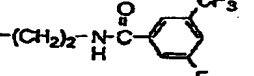
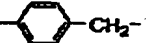
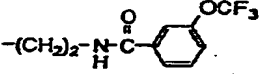
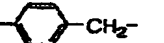
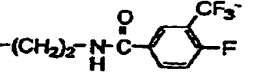
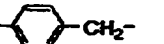
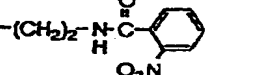
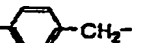
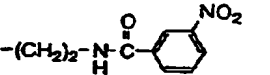
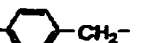
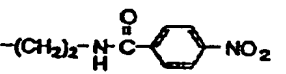
[0109]

Tabl 1.9

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_r \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
89		1	2	0	S	H	
90		1	2	0	S	H	
91		1	2	0	S	H	
92		1	2	0	S	H	
93		1	2	0	S	H	
94		1	2	0	S	H	
95		1	2	0	S	H	
96		1	2	0	S	H	
97		1	2	0	S	H	
98		1	2	0	S	H	
99		1	2	0	S	H	

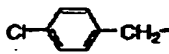
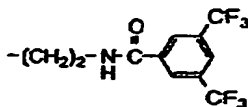
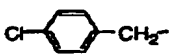
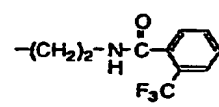
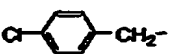
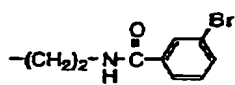

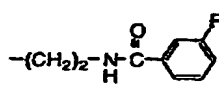
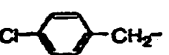
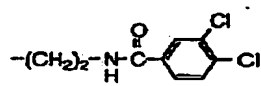
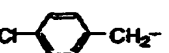
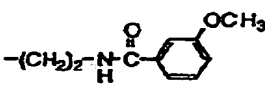
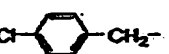
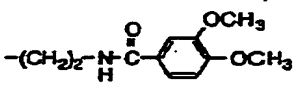
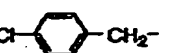
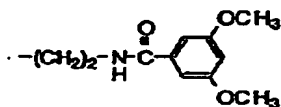
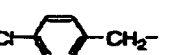
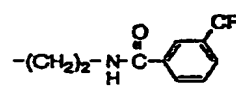
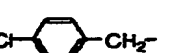
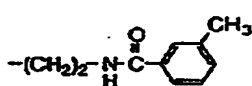
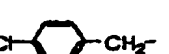
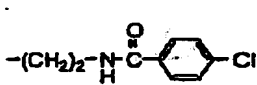
[0110]

Tabl 1.10

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
100		1	2	0	S	H	
101		1	2	0	S	H	
102		1	2	0	S	H	
103		1	2	0	S	H	
104		1	2	0	S	H	
105		1	2	0	S	H	
106		1	2	0	S	H	
107		1	2	0	S	H	
108		1	2	0	S	H	
109		1	2	0	S	H	
110		1	2	0	S	H	



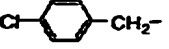
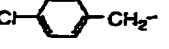
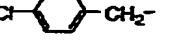
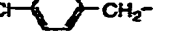
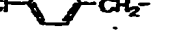




[0111]

Table 1.11

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
111		1	2	0	R	H	
112		1	2	0	R	H	
113		1	2	0	R	H	
114		1	2	0	R	H	
115		1	2	0	R	H	
116		1	2	0	R	H	
117		1	2	0	R	H	
118		1	2	0	R	H	
119		1	2	0	R	H	
120		1	2	0	R	H	
121		1	2	0	R	H	


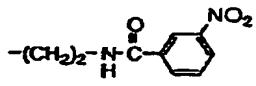
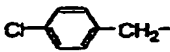
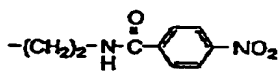

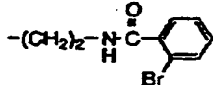
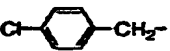
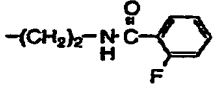
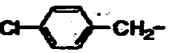
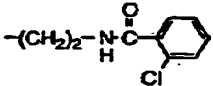

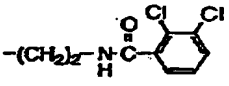
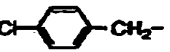
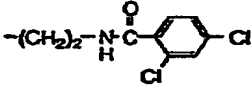
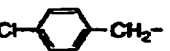
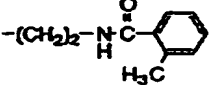
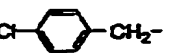
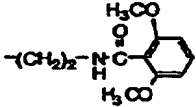
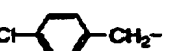
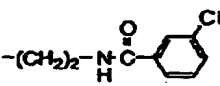

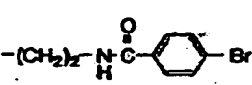
【0112】

Table 1.12

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_2-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
122		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-OCH_3$
123		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_2Cl_2$
124		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CN$
125		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(OCH_2)_2$
126		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(CF_3)$
127		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(CF_3)$
128		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(CF_3)$
129		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(CF_3)$
130		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-OCF_3$
131		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(CF_3)$
132		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-O_2N$


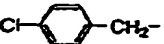
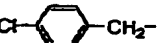
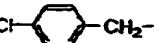
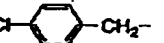
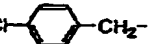
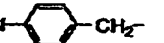
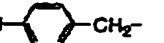
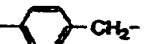
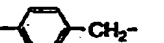
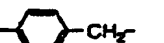
[0113]

Tabl 1.13

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
133		1	2	0	R	H	
134		1	2	0	R	H	
135		1	2	0	R	H	
136		1	2	0	R	H	
137		1	2	0	R	H	
138		1	2	0	R	H	
139		1	2	0	R	H	
140		1	2	0	R	H	
141		1	2	0	R	H	
142		1	2	0	R	H	
143		1	2	0	R	H	


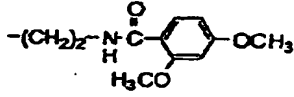
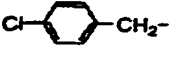
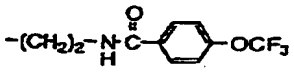
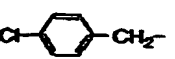
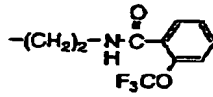
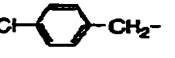
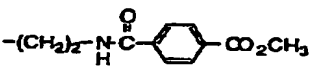
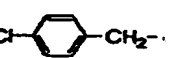
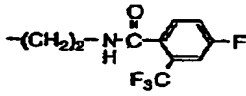
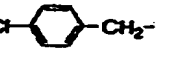
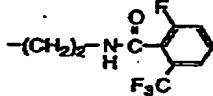
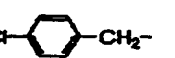
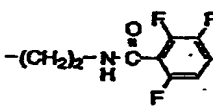
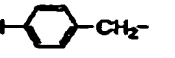
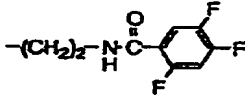
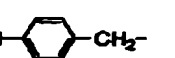
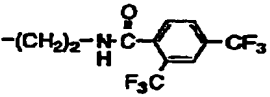
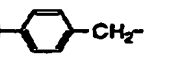
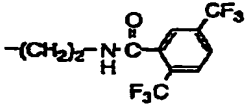
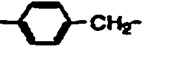
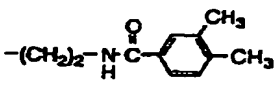
[0 1 1 4]

Table 1.14

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
144		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-C_6H_5$
145		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
146		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CH_3$
147		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CH_2CH_3$
148		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CN$
149		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-C_6H_5$
150		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_4-C_6H_5$
151		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)_2$
152		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)_2$
153		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)_2$
154		1	2	0	R	H	$-(CH_2)_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)_2$

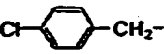
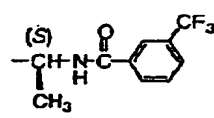
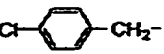
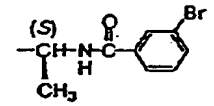
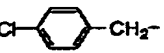
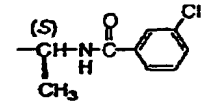
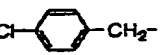
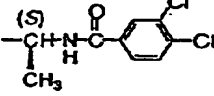
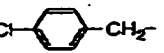
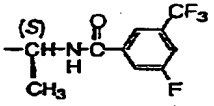
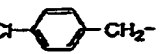
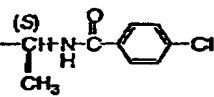
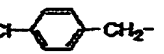
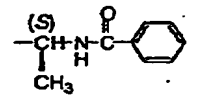
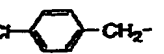
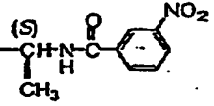
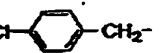
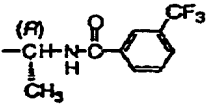
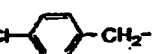
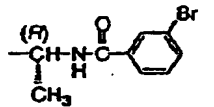
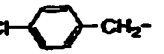
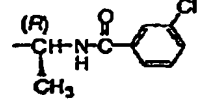
[0115]

Tabl 1.15

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
155		1	2	0	R	H	
156		1	2	0	R	H	
157		1	2	0	R	H	
158		1	2	0	R	H	
159		1	2	0	R	H	
160		1	2	0	R	H	
161		1	2	0	R	H	
162		1	2	0	R	H	
163		1	2	0	R	H	
164		1	2	0	R	H	
165		1	2	0	R	H	


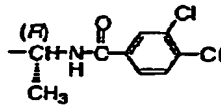
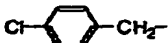
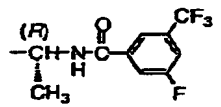
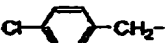
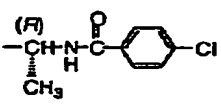
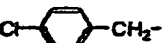
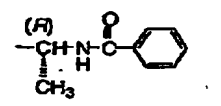
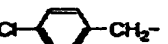
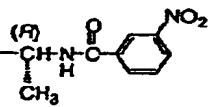

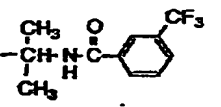
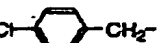
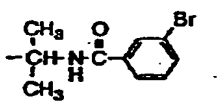
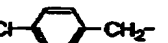
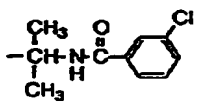

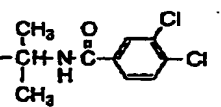
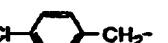
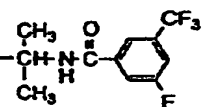

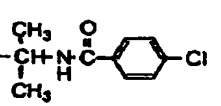
[0116]

Tabl 1.16

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_f \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
166		1	2	0	R	H	
167		1	2	0	R	H	
168		1	2	0	R	H	
169		1	2	0	R	H	
170		1	2	0	R	H	
171		1	2	0	R	H	
172		1	2	0	R	H	
173		1	2	0	R	H	
174		1	2	0	R	H	
175		1	2	0	R	H	
176		1	2	0	R	H	

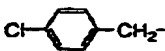
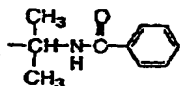

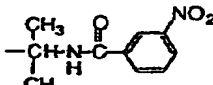
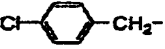
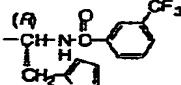
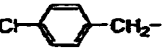
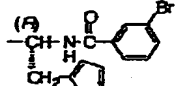

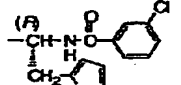
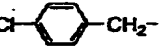
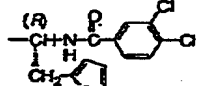
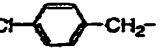
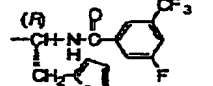
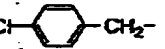
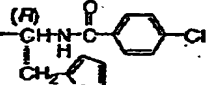
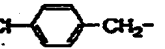
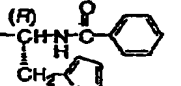
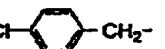
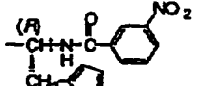
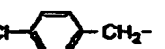
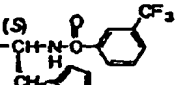
[0117]

Tabl 1.17

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
177		1	2	0	R	H	
178		1	2	0	R	H	
179		1	2	0	R	H	
180		1	2	0	R	H	
181		1	2	0	R	H	
182		1	2	0	R	H	
183		1	2	0	R	H	
184		1	2	0	R	H	
185		1	2	0	R	H	
186		1	2	0	R	H	
187		1	2	0	R	H	

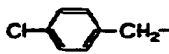
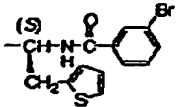
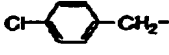
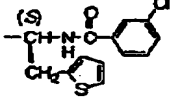
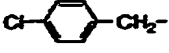
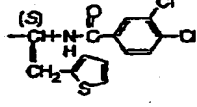

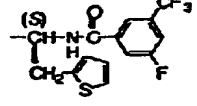

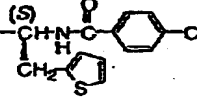
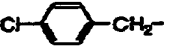
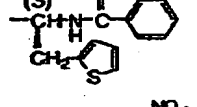

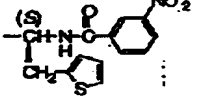
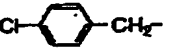
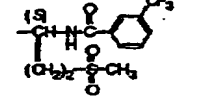
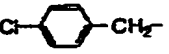
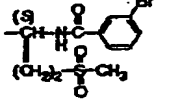

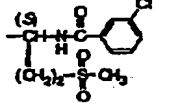
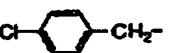
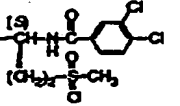
[0118]

Table 1.18

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
188		1	2	0	R	H	
189		1	2	0	R	H	
190		1	2	0	R	H	
191		1	2	0	R	H	
192		1	2	0	R	H	
193		1	2	0	R	H	
194		1	2	0	R	H	
195		1	2	0	R	H	
196		1	2	0	R	H	
197		1	2	0	R	H	
198		1	2	0	R	H	

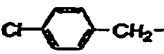
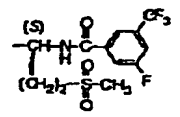

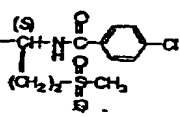
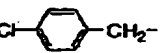
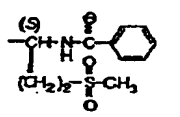
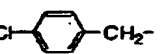
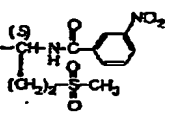
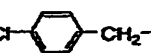
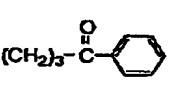
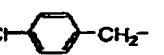
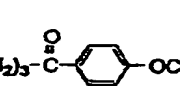
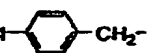
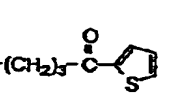
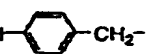
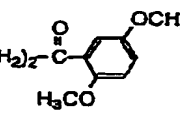
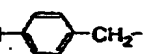
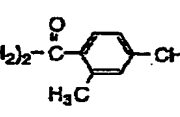
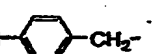
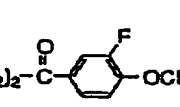
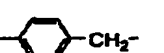
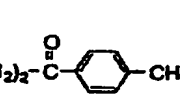
[0 1 1 9]

Tabl 1.19

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_r \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
199		1	2	0	R	H	
200		1	2	0	R	H	
201		1	2	0	R	H	
202		1	2	0	R	H	
203		1	2	0	R	H	
204		1	2	0	R	H	
205		1	2	0	R	H	
206		1	2	0	R	H	
207		1	2	0	R	H	
208		1	2	0	R	H	
209		1	2	0	R	H	












[0120]

Tabl T.20

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
210		1	2	0	R	H	
211		1	2	0	R	H	
212		1	2	0	R	H	
213		1	2	0	R	H	
214		1	2	0	-	H	
215		1	2	0	-	H	
216		1	2	0	-	H	
217		1	2	0	-	H	
218		1	2	0	-	H	
219		1	2	0	-	H	
220		1	2	0	-	H	


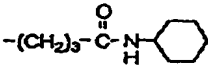

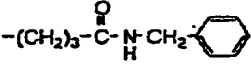

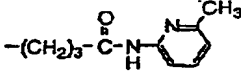

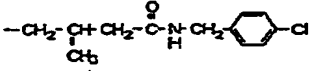
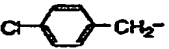
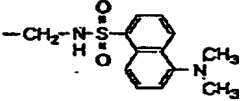
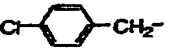
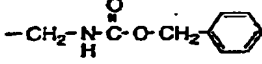
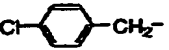
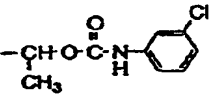
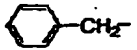
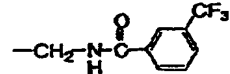
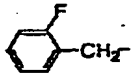
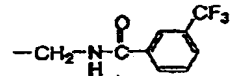
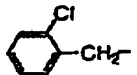
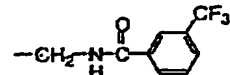
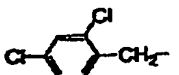
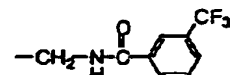
【0121】

Tabl 1.21

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array} -G-R^6$
221		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2-C(=O)-C_6H_5$
222		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2-C(=O)-C_6H_4-Cl$
223		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_2-C(=O)-C_6H_4-O(CH_2)_3CH_3$
224		1	2	0	-	H	$-CH_2-SO_2-C_6H_4-CH_3$
225		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3-C(=O)-NH-C_6H_5$
226		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3-C(=O)-NH-C_6H_4-OCH_3$
227		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3-C(=O)-NH-C_6H_4-Cl$
228		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3-C(=O)-NH-C_6H_4-OCH_3$
229		1	2	0	-	H	$-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-C(=O)-NH-C_6H_4-CH_3$
230		1	2	0	-	H	$-CH_2-C(CH_2-CH_2-C_5H_9)-C(=O)-NH-C_6H_4-F$
231		1	2	0	-	H	$-(CH_2)_3-C(=O)-NH-C_6H_4-C(=O)-CH_3$

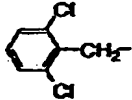
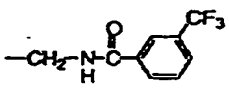
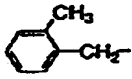
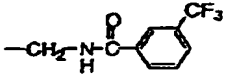
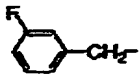
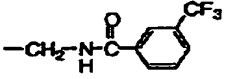
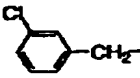
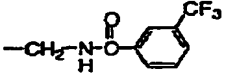
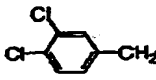
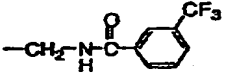
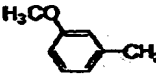
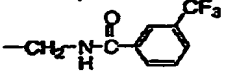
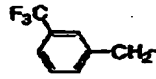
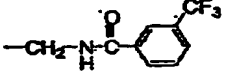
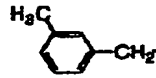
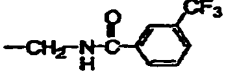
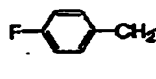
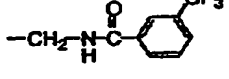
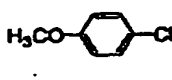
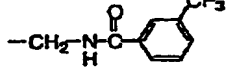
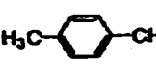
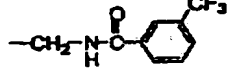
[0 1 2 2]

Table 1.22

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
232		1	2	0	-	H	
233		1	2	0	-	H	
234		1	2	0	-	H	
235		1	2	0	-	H	
236		1	2	0	-	H	
237		1	2	0	-	H	
238		1	2	0	-	H	
239		1	2	0	S	H	
240		1	2	0	S	H	
241		1	2	0	S	H	
242		1	2	0	S	H	

[0123]

Table 1.23

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
243		1	2	0	S	H	
244		1	2	0	S	H	
245		1	2	0	S	H	
246		1	2	0	S	H	
247		1	2	0	S	H	
248		1	2	0	S	H	
249		1	2	0	S	H	
250		1	2	0	S	H	
251		1	2	0	S	H	
252		1	2	0	S	H	
253		1	2	0	S	H	

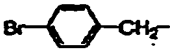
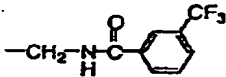
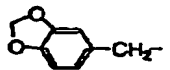
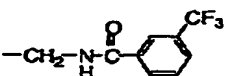
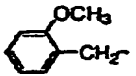
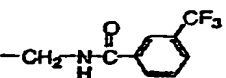
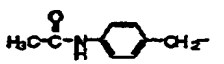
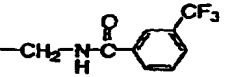
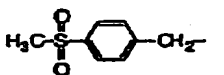
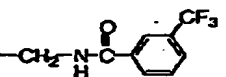
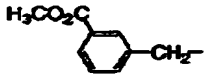
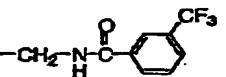
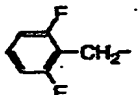
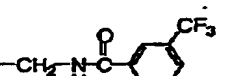
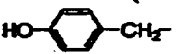
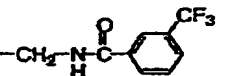
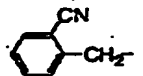
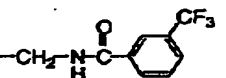
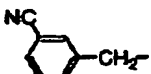
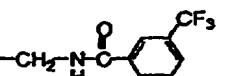

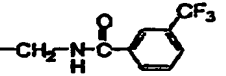
[0124]

Table 1.24

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
254		1	2	0	S	H	
255		1	2	0	S	H	
256		1	2	0	S	H	
257		1	2	0	S	H	
258		1	2	0	S	H	
259		1	2	0	S	H	
260		1	2	0	S	H	
261		1	2	0	S	H	
262		1	2	0	S	H	
263		1	2	0	S	H	
264		1	2	0	S	H	

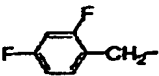
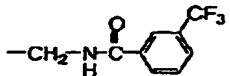
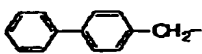
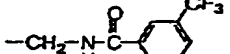

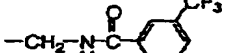
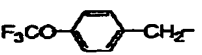
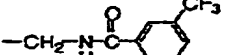
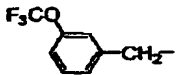
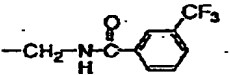

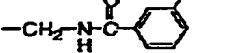

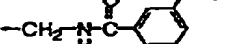
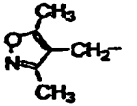
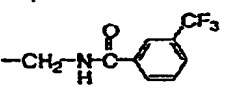
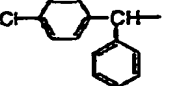
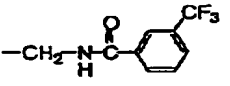
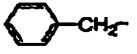
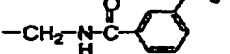
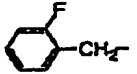
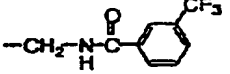
【0125】

Table 1.25

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
265		1	2	0	S	H	
266		1	2	0	S	H	
267		1	2	0	S	H	
268		1	2	0	S	H	
269		1	2	0	S	H	
270		1	2	0	S	H	
271		1	2	0	S	H	
272		1	2	0	S	H	
273		1	2	0	S	H	
274		1	2	0	S	H	
275		1	2	0	S	H	

[0126]

Table 1.26

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
276		1	2	0	S	H	
277		1	2	0	S	H	
278		1	2	0	S	H	
279		1	2	0	S	H	
280		1	2	0	S	H	
281		1	2	0	S	H	
282		1	2	0	S	H	
283		1	2	0	S	H	
284		1	2	0	S	H	
285		1	2	0	R	H	
286		1	2	0	R	H	

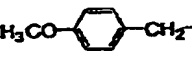
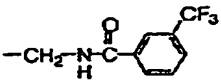
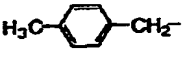
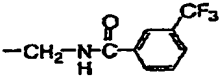
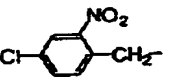
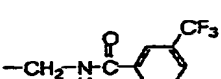
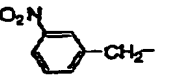
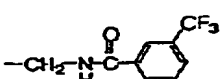
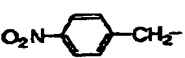
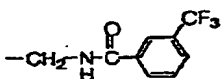
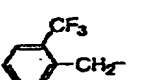
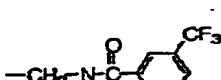
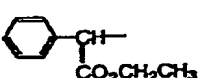
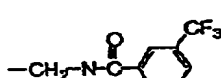
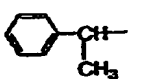
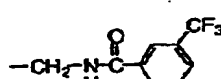
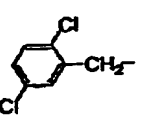
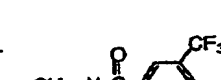
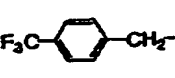
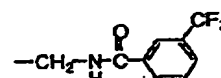
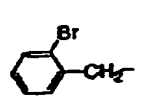
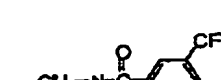
[0127]

Tabl 1.27

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
287		1	2	0	R	H	
288		1	2	0	R	H	
289		1	2	0	R	H	
290		1	2	0	R	H	
291		1	2	0	R	H	
292		1	2	0	R	H	
293		1	2	0	R	H	
294		1	2	0	R	H	
295		1	2	0	R	H	
296		1	2	0	R	H	
297		1	2	0	R	H	

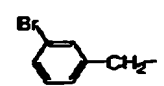
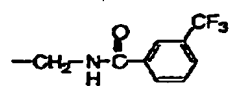
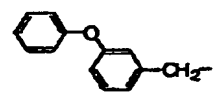
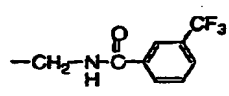
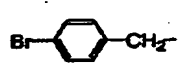
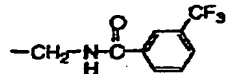
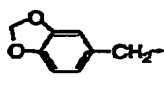
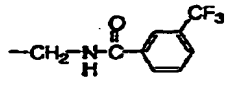
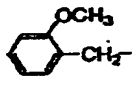
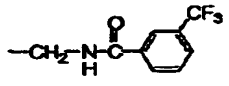
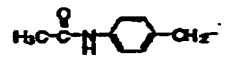
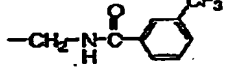
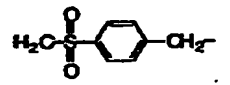
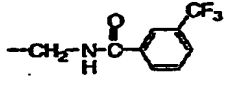
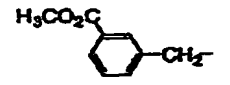
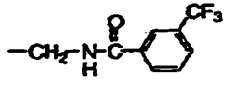
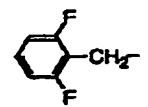
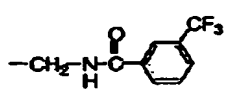
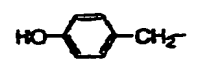
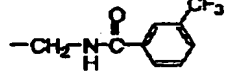
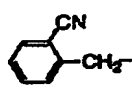
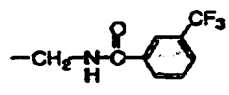
[0128]

Table 1.28

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
298		1	2	0	R	H	
299		1	2	0	R	H	
300		1	2	0	R	H	
301		1	2	0	R	H	
302		1	2	0	R	H	
303		1	2	0	R	H	
304		1	2	0	R	H	
305		1	2	0	R	H	
306		1	2	0	R	H	
307		1	2	0	R	H	
308		1	2	0	R	H	

[0129]

Table 1.29

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
309		1	2	0	R	H	
310		1	2	0	R	H	
311		1	2	0	R	H	
312		1	2	0	R	H	
313		1	2	0	R	H	
314		1	2	0	R	H	
315		1	2	0	R	H	
316		1	2	0	R	H	
317		1	2	0	R	H	
318		1	2	0	R	H	
319		1	2	0	R	H	

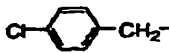
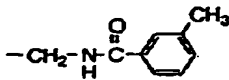
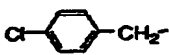
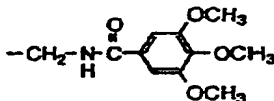

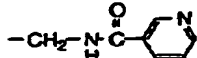

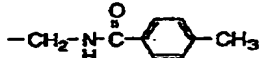

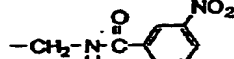
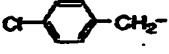
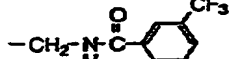

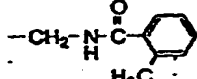
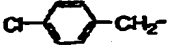
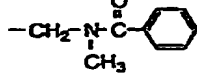
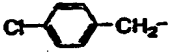
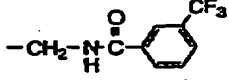
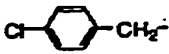
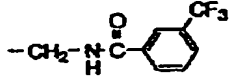
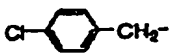
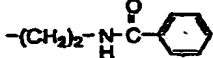
[0 1 3 0]

Table 1.30

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
320		1	2	0	R	H	
321		1	2	0	R	H	
322		1	2	0	R	H	
323		1	2	0	R	H	
324		1	2	0	R	H	
325		1	2	0	R	H	
326		1	2	0	R	H	
327		1	2	0	R	H	
328		1	2	0	R	H	
329		1	2	0	R	H	
330		0	3	1	-	H	


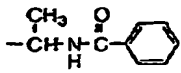

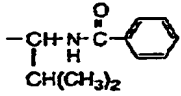

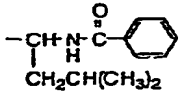

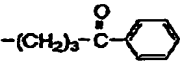
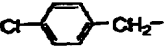
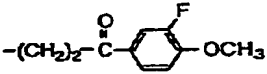
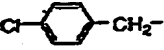
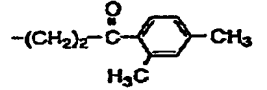

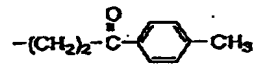

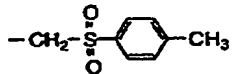

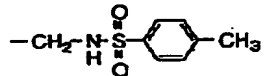

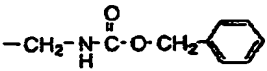

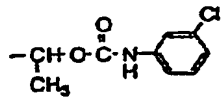
[0131]

Tabl 1.31

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q - G - R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
331		0	3	1	-	H	
332		0	3	1	-	H	
333		0	3	1	-	H	
334		0	3	1	-	H	
335		0	3	1	-	H	
336		0	3	1	-	H	
337		0	3	1	-	H	
338		0	3	1	-	H	
339		0	3	1	R	H	
340		0	3	1	S	H	
341		0	3	1	-	H	

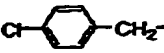
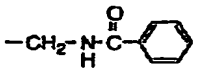
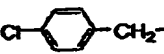
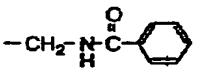
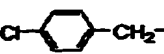
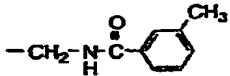
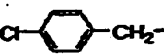
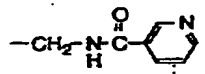

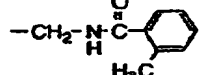
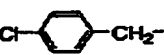
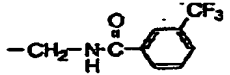
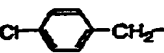
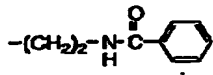

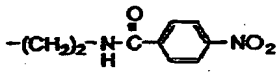

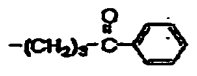
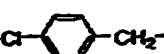
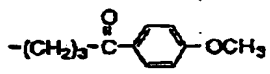

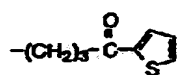
[0 1 3 2]

Table 1.32

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
342		0	3	1	-	H	
343		0	3	1	-	H	
344		0	3	1	-	H	
345		0	3	1	-	H	
346		0	3	1	-	H	
347		0	3	1	-	H	
348		0	3	1	-	H	
349		0	3	1	-	H	
350		0	3	1	-	H	
351		0	3	1	-	H	
352		0	3	1	-	H	

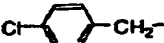
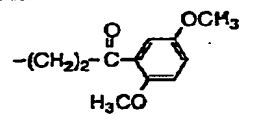
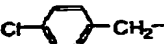
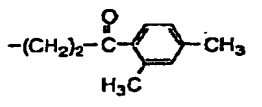

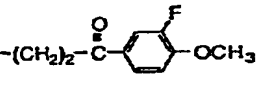

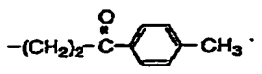
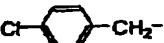
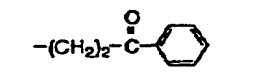

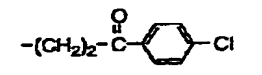

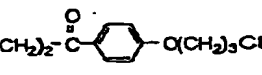

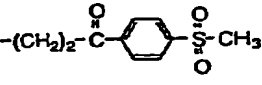

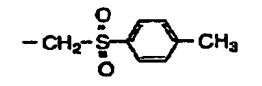

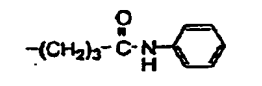
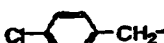
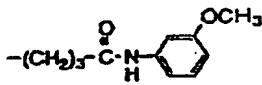
[0 1 3 3]

Tabl 1.33

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
353		1	2	1	-	H	
354		1	3	0	-	H	
355		1	3	0	-	H	
356		1	3	0	-	H	
357		1	3	0	-	H	
358		1	3	0	-	H	
359		1	3	0	-	H	
360		1	3	0	-	H	
361		1	3	0	-	H	
362		1	3	0	-	H	
363		1	3	0	-	H	

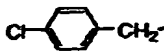
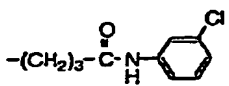

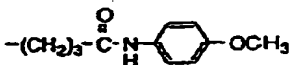
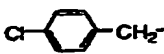
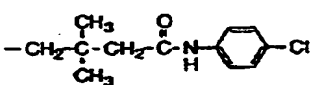

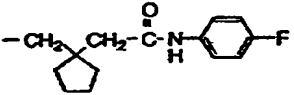
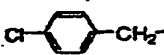
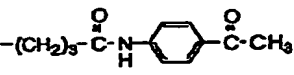
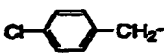
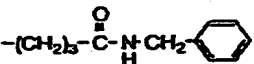

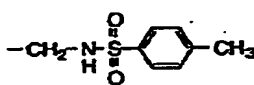
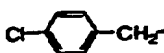
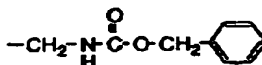

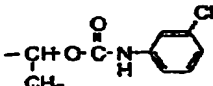

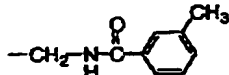

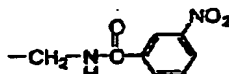
【0 1 3 4】

Table 1.34

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_f \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
364		1	3	0	-	H	
365		1	3	0	-	H	
366		1	3	0	-	H	
367		1	3	0	-	H	
368		1	3	0	-	H	
369		1	3	0	-	H	
370		1	3	0	-	H	
371		1	3	0	-	H	
372		1	3	0	-	H	
373		1	3	0	-	H	
374		1	3	0	-	H	

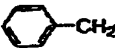
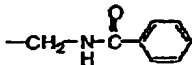
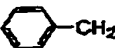
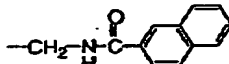
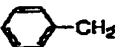
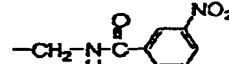
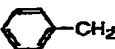
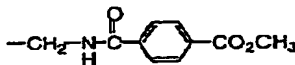
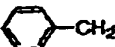
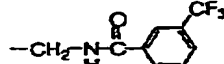
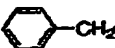
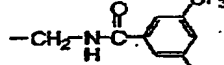
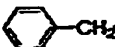
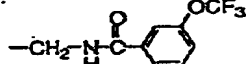
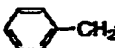
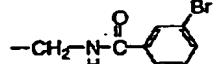
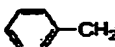
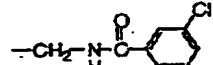
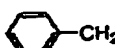
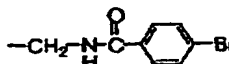
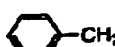
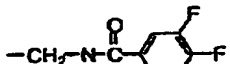
[0135]

Table 1.35

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
375		1	3	0	-	H	
376		1	3	0	-	H	
377		1	3	0	-	H	
378		1	3	0	-	H	
379		1	3	0	-	H	
380		1	3	0	-	H	
381		1	3	0	-	H	
382		1	3	0	-	H	
383		1	3	0	-	H	
384		2	2	0	-	H	
385		2	2	0	-	H	

[0136]

Table 1.36

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_f -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
386	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
387	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
388	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
389	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
390	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
391	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
392	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
393	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
394	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
395	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	
396	 -CH ₂ -	2	2	0	-	H	

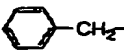
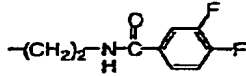
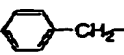
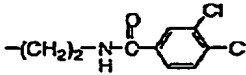
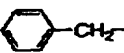
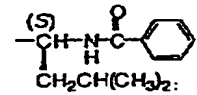
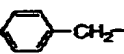
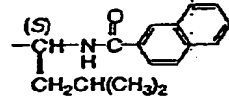
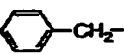
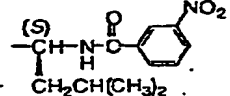
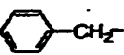
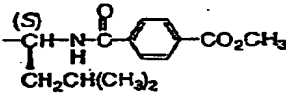
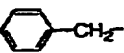
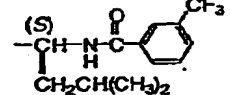
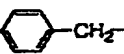
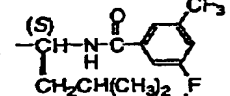
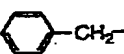
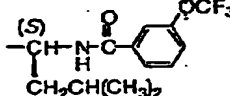
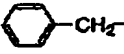
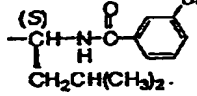
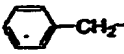
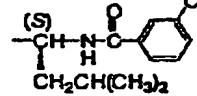
[0137]

Tabl 1.37

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
397		2	2	0	-	H	
398		2	2	0	-	H	
399		2	2	0	-	H	
400		2	2	0	-	H	
401		2	2	0	-	H	
402		2	2	0	-	H	
403		2	2	0	-	H	
404		2	2	0	-	H	
405		2	2	0	-	H	
406		2	2	0	-	H	
407		2	2	0	-	H	

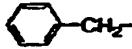
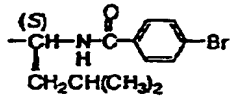
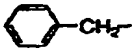
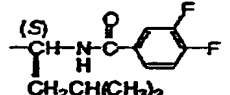
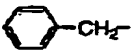
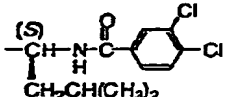
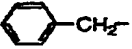
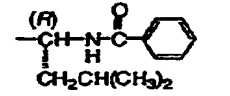
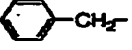
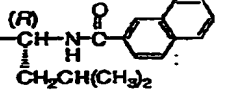
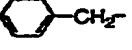
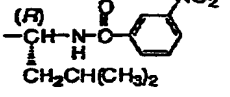
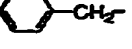
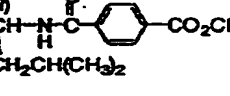

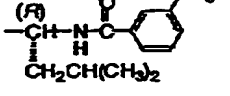

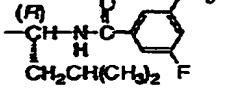
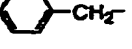
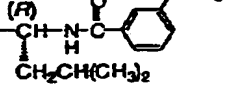
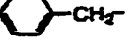
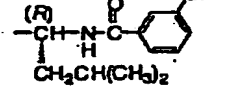
[0138]

Table 1.38

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{R^4}{\underset{R^5}{ }}-(CH_2)_q-G-R^6$
408		2	2	0	-	H	
409		2	2	0	-	H	
410		2	2	0	-	H	
411		2	2	0	-	H	
412		2	2	0	-	H	
413		2	2	0	-	H	
414		2	2	0	-	H	
415		2	2	0	-	H	
416		2	2	0	-	H	
417		2	2	0	-	H	
418		2	2	0	-	H	

[0139]

Table 1.39

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array} -G-R^6$
419		2	2	0	-	H	
420		2	2	0	-	H	
421		2	2	0	-	H	
422		2	2	0	-	H	
423		2	2	0	-	H	
424		2	2	0	-	H	
425		2	2	0	-	H	
426		2	2	0	-	H	
427		2	2	0	-	H	
428		2	2	0	-	H	
429		2	2	0	-	H	


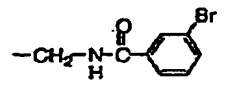

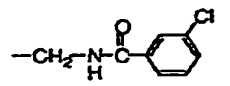

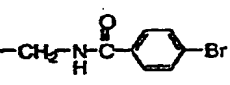

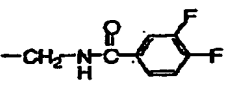

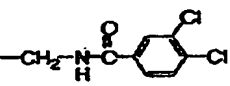

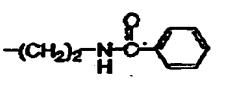

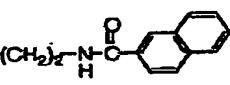

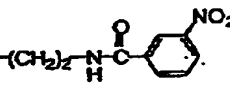
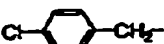
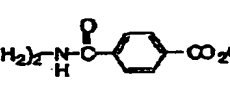

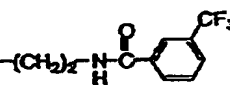

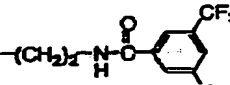
【 0 1 4 0 】

Table 1.40

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
430		2	2	0	-	H	
431		2	2	0	-	H	
432		2	2	0	-	H	
433		2	2	0	-	H	
434		1	3	1	-	H	
435		1	3	1	-	H	
436		1	3	1	-	H	
437		1	3	1	-	H	
438		1	3	1	-	H	
439		1	3	1	-	H	
440		1	3	1	-	H	

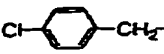
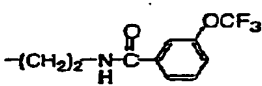
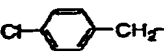
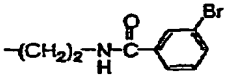
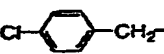
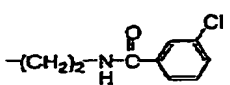
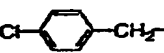
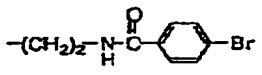
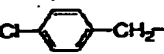
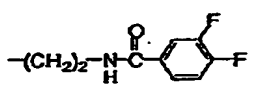
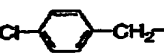
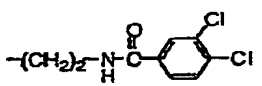

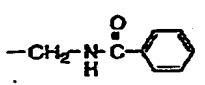
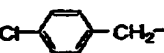
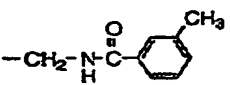
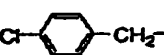
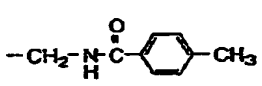
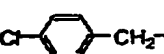
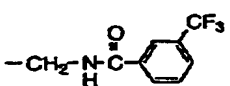

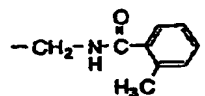
【0 1 4 1】

Table 1.41

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
441		1	3	1	-	H	
442		1	3	1	-	H	
443		1	3	1	-	H	
444		1	3	1	-	H	
445		1	3	1	-	H	
446		1	3	1	-	H	
447		1	3	1	-	H	
448		1	3	1	-	H	
449		1	3	1	-	H	
450		1	3	1	-	H	
451		1	3	1	-	H	

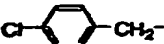
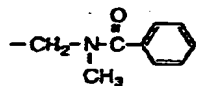

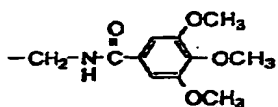

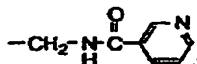

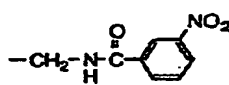

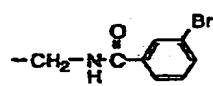

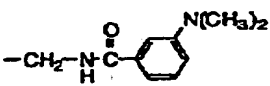
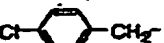
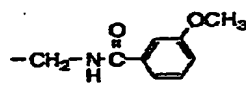

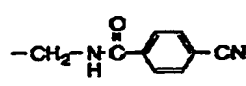

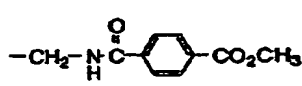
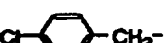
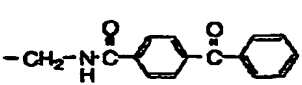

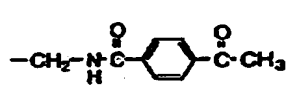
[0142]

Table 1.42

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} - (CH_2)_l -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
452		1	3	1	-	H	
453		1	3	1	-	H	
454		1	3	1	-	H	
455		1	3	1	-	H	
456		1	3	1	-	H	
457		1	3	1	-	H	
458		2	2	1	-	H	
459		2	2	1	-	H	
460		2	2	1	-	H	
461		2	2	1	-	H	
462		2	2	1	-	H	

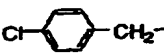
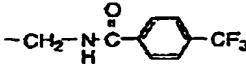
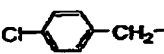
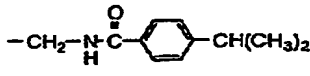

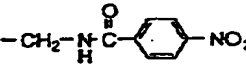
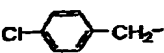
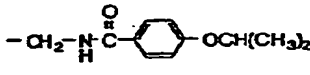

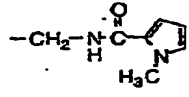
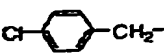
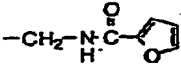
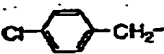
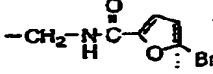

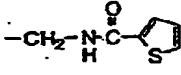

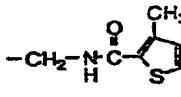
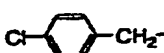
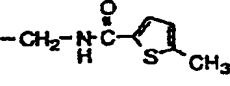

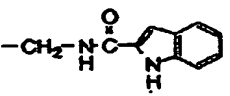
【0 1 4 3】

Tabl 1.43

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
463		2	2	1	-	H	
464		2	2	1	-	H	
465		2	2	1	-	H	
466		2	2	1	-	H	
467		2	2	1	-	H	
468		2	2	1	-	H	
469		2	2	1	-	H	
470		2	2	1	-	H	
471		2	2	1	-	H	
472		2	2	1	-	H	
473		2	2	1	-	H	

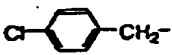
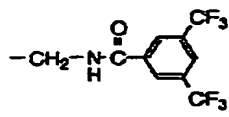
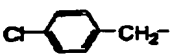
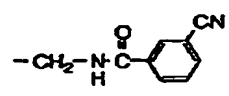

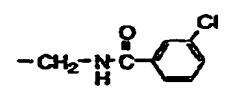
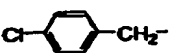
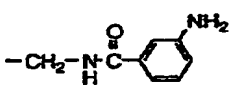

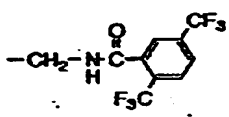

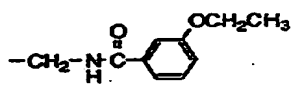

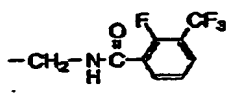

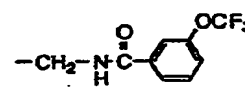

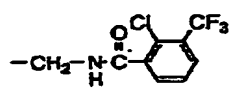
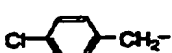
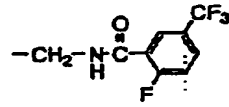

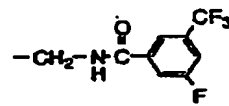
【0144】

Tabl 1.44

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
474		2	2	1	-	H	
475		2	2	1	-	H	
476		2	2	1	-	H	
477		2	2	1	-	H	
478		2	2	1	-	H	
479		2	2	1	-	H	
480		2	2	1	-	H	
481		2	2	1	-	H	
482		2	2	1	-	H	
483		2	2	1	-	H	
484		2	2	1	-	H	

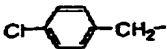
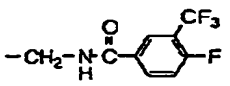

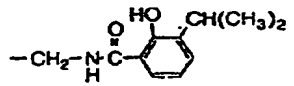

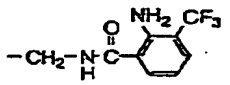
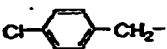
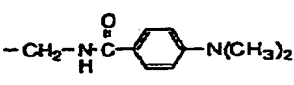
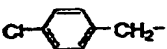
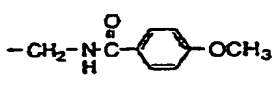
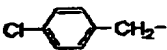
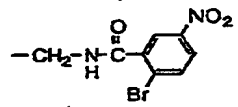

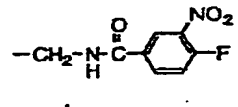

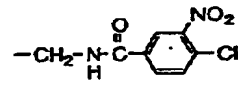

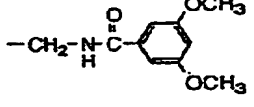
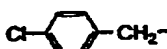
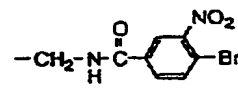

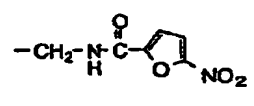
[0 1 4 5]

Tabl 1.45

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
485		2	2	1	-	H	
486		2	2	1	-	H	
487		2	2	1	-	H	
488		2	2	1	-	H	
489		2	2	1	-	H	
490		2	2	1	-	H	
491		2	2	1	-	H	
492		2	2	1	-	H	
493		2	2	1	-	H	
494		2	2	1	-	H	
495		2	2	1	-	H	


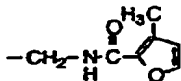

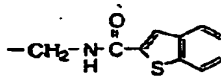
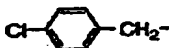
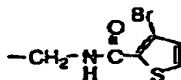

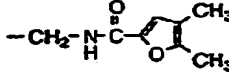

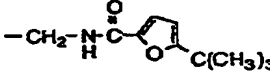
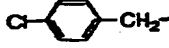
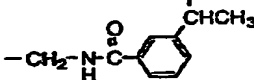

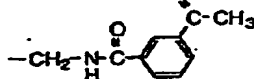

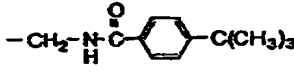

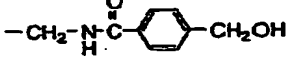

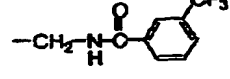

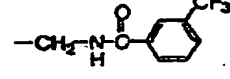
[0146]

Tabl 1.46

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ (CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{matrix} -G-R^6$
496		2	2	1	-	H	
497		2	2	1	-	H	
498		2	2	1	-	H	
499		2	2	1	-	H	
500		2	2	1	-	H	
501		2	2	1	-	H	
502		2	2	1	-	H	
503		2	2	1	-	H	
504		2	2	1	-	H	
505		2	2	1	-	H	
506		2	2	1	-	H	

[0147]

Tabl 1.47

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q-G-R^6$
507		2	2	1	-	H	
508		2	2	1	-	H	
509		2	2	1	-	H	
510		2	2	1	-	H	
511		2	2	1	-	H	
512		2	2	1	-	H	
513		2	2	1	-	H	
514		2	2	1	-	H	
515		2	2	1	-	H	
516		2	2	1	-	H	
517		2	2	1	-	H	


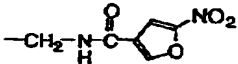

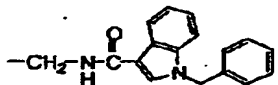
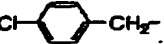
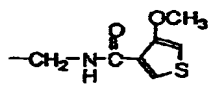

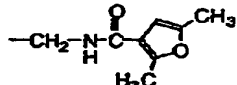

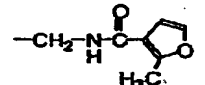

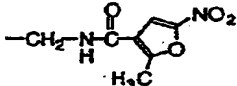
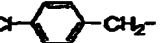
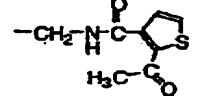
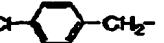
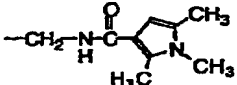
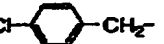
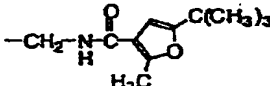
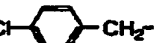
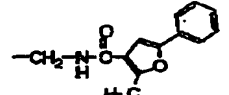
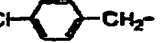
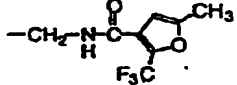
[0148]

Table 1.48

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q G-R^6$
518		2	2	1	-	H	
519		2	2	1	-	H	
520		2	2	1	-	-CH3	
521		2	2	1	-		
522		2	2	1	-		
523		2	2	1	-		
524		2	2	1	-		
525		2	2	1	-	H	
526		2	2	1	-	H	
527		2	2	1	-	H	
528		2	2	1	-	H	


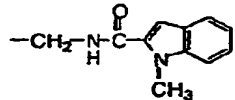

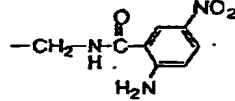

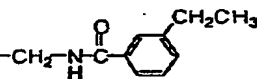
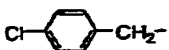
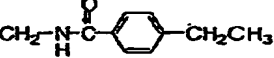

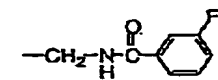

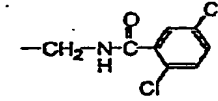
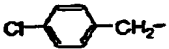
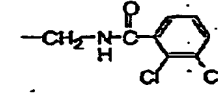

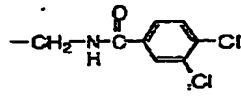

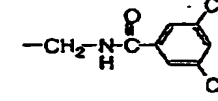
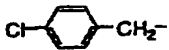
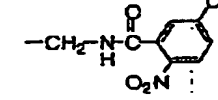
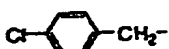
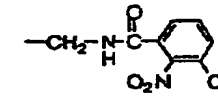
【0149】

Table 1.49

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
529		2	2	1	-	H	
530		2	2	1	-	H	
531		2	2	1	-	H	
532		2	2	1	-	H	
533		2	2	1	-	H	
534		2	2	1	-	H	
535		2	2	1	-	H	
536		2	2	1	-	H	
537		2	2	1	-	H	
538		2	2	1	-	H	
539		2	2	1	-	H	

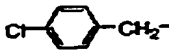
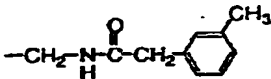
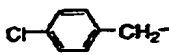
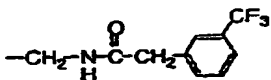

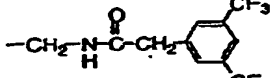
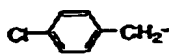
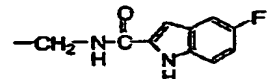
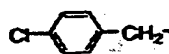
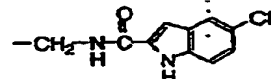
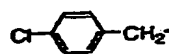
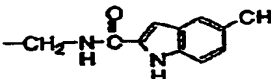

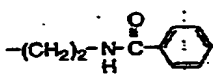

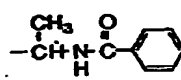

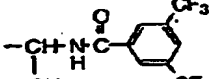

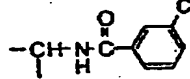

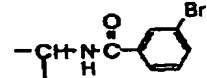
[0150]

Table 1.50

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
540		2	2	1	-	H	
541		2	2	1	-	H	
542		2	2	1	-	H	
543		2	2	1	-	H	
544		2	2	1	-	H	
545		2	2	1	-	H	
546		2	2	1	-	H	
547		2	2	1	-	H	
548		2	2	1	-	H	
549		2	2	1	-	H	
550		2	2	1	-	H	

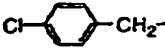
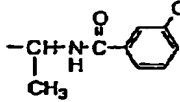

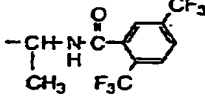
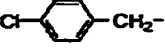
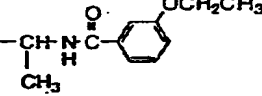
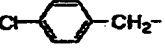
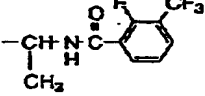
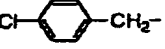
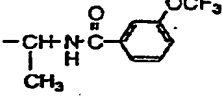

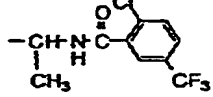

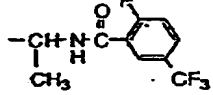

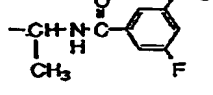
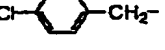
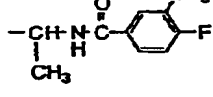

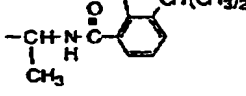

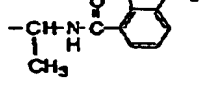
[0151]

Tabl 1.51

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
551		2	2	1	-	H	
552		2	2	1	-	H	
553		2	2	1	-	H	
554		2	2	1	-	H	
555		2	2	1	-	H	
556		2	2	1	-	H	
557		2	2	1	-	H	
558		2	2	1	-	H	
559		2	2	1	-	H	
560		2	2	1	-	H	
561		2	2	1	-	H	

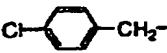
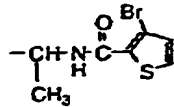

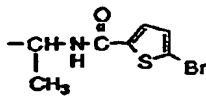
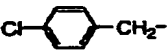
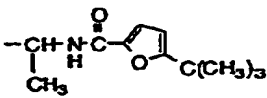
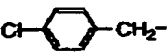
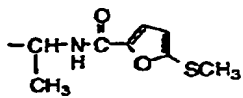
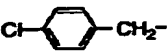
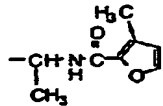
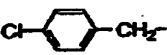
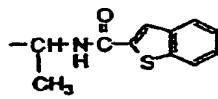
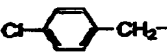
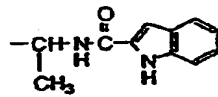

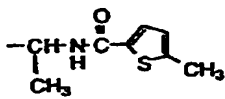
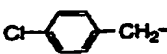
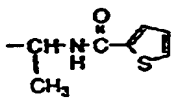
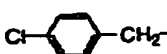
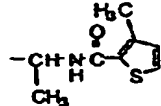

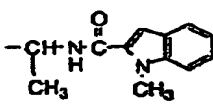
[0152]

Tabl 1.52

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
562		2	2	1	-	H	
563		2	2	1	-	H	
564		2	2	1	-	H	
565		2	2	1	-	H	
566		2	2	1	-	H	
567		2	2	1	-	H	
568		2	2	1	-	H	
569		2	2	1	-	H	
570		2	2	1	-	H	
571		2	2	1	-	H	
572		2	2	1	-	H	


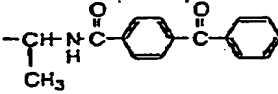

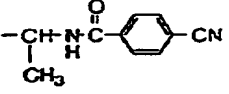

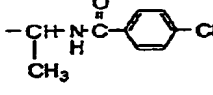

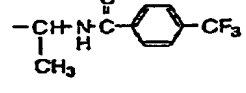
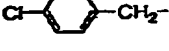
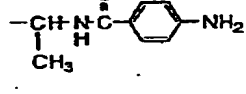
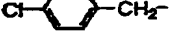
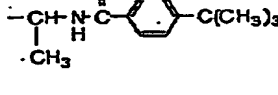

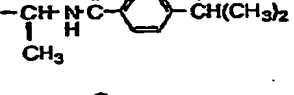

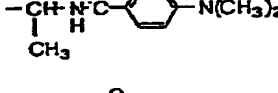

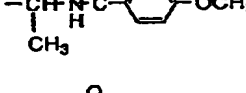
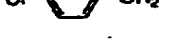
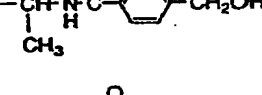

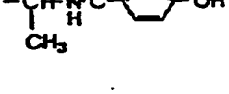
【0153】

Table 1.53

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
573		2	2	1	-	H	
574		2	2	1	-	H	
575		2	2	1	-	H	
576		2	2	1	-	H	
577		2	2	1	-	H	
578		2	2	1	-	H	
579		2	2	1	-	H	
580		2	2	1	-	H	
581		2	2	1	-	H	
582		2	2	1	-	H	
583		2	2	1	-	H	

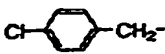
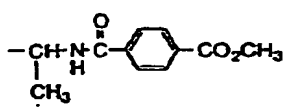
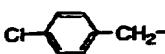
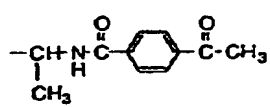
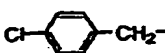
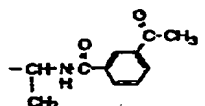
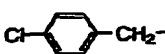
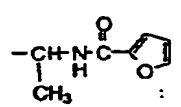
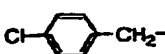
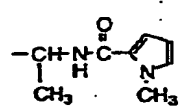
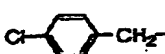
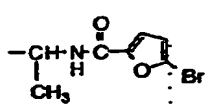

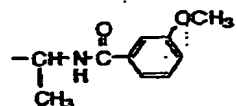

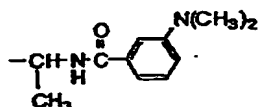
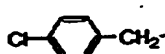
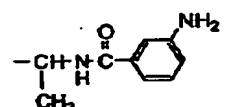

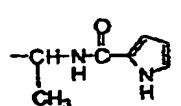

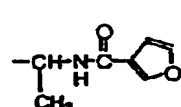
[0154]

Table 1.54

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_f \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ C \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
584		2	2	1	-	H	
585		2	2	1	-	H	
586		2	2	1	-	H	
587		2	2	1	-	H	
588		2	2	1	-	H	
589		2	2	1	-	H	
590		2	2	1	-	H	
591		2	2	1	-	H	
592		2	2	1	-	H	
593		2	2	1	-	H	
594		2	2	1	-	H	


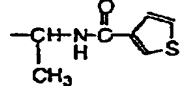

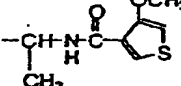

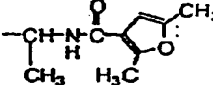

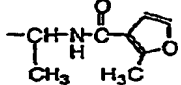

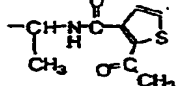

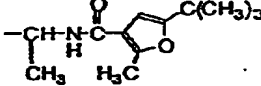

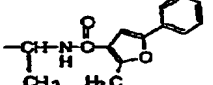
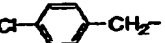
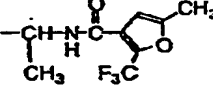
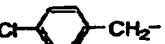
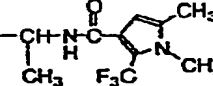
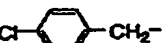
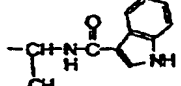

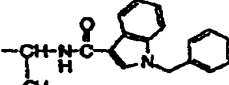
[0155]

Tabl 1.55

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
595		2	2	1	-	H	
596		2	2	1	-	H	
597		2	2	1	-	H	
598		2	2	1	-	H	
599		2	2	1	-	H	
600		2	2	1	-	H	
601		2	2	1	-	H	
602		2	2	1	-	H	
603		2	2	1	-	H	
604		2	2	1	-	H	
605		2	2	1	-	H	

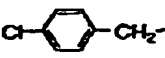
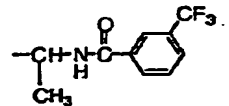
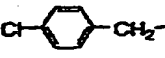
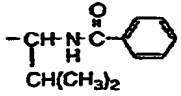

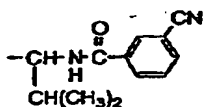
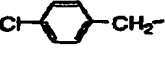
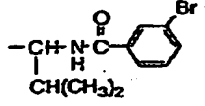
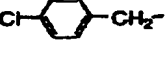
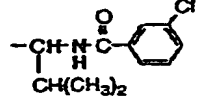
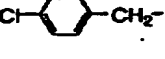
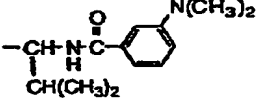
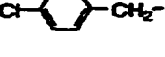
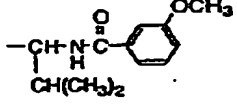
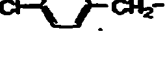
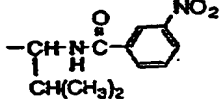
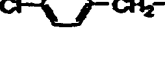
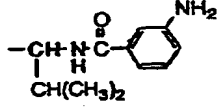

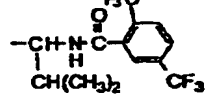

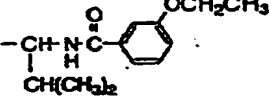
[0156]

Table 1.56

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
606		2	2	1	-	H	
607		2	2	1	-	H	
608		2	2	1	-	H	
609		2	2	1	-	H	
610		2	2	1	-	H	
611		2	2	1	-	H	
612		2	2	1	-	H	
613		2	2	1	-	H	
614		2	2	1	-	H	
615		2	2	1	-	H	
616		2	2	1	-	H	


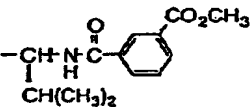
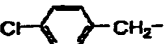
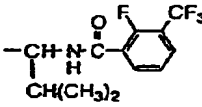

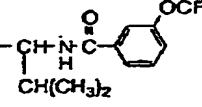
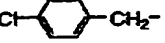
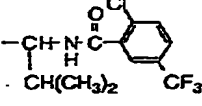
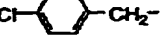
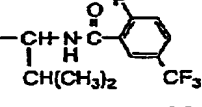
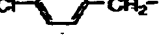
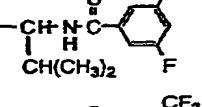
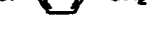
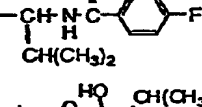

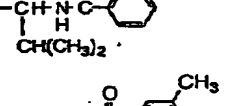
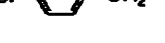
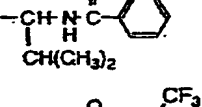

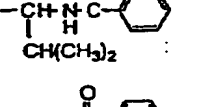

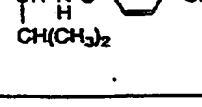
【0157】

Table 1.57

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_f \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
617		2	2	1	-	H	
618		2	2	1	-	H	
619		2	2	1	-	H	
620		2	2	1	-	H	
621		2	2	1	-	H	
622		2	2	1	-	H	
623		2	2	1	-	H	
624		2	2	1	-	H	
625		2	2	1	-	H	
626		2	2	1	-	H	
627		2	2	1	-	H	

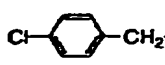
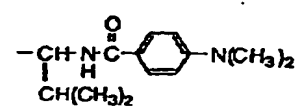
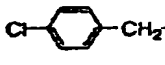
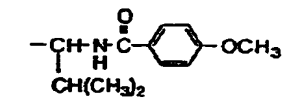
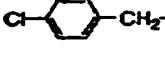
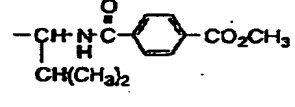
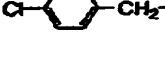
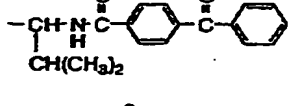

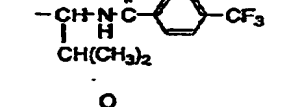

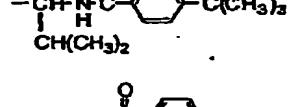

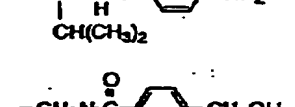

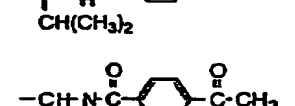

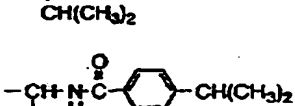

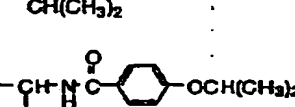
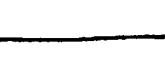
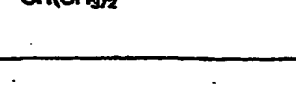
[0158]

Table 1.58

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
628		2	2	1	-	H	
629		2	2	1	-	H	
630		2	2	1	-	H	
631		2	2	1	-	H	
632		2	2	1	-	H	
633		2	2	1	-	H	
634		2	2	1	-	H	
635		2	2	1	-	H	
636		2	2	1	-	H	
637		2	2	1	-	H	
638		2	2	1	-	H	

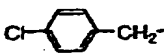
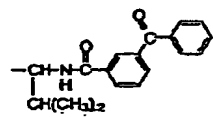
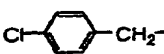
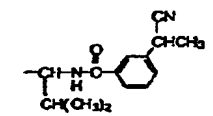

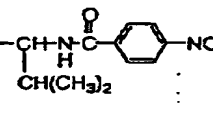
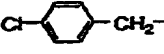
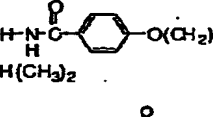
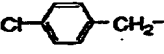
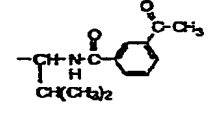

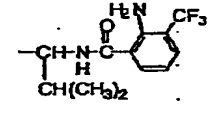
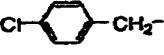
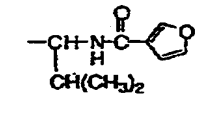
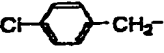
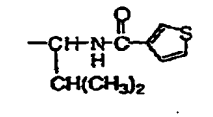

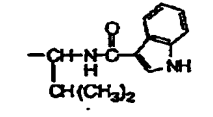

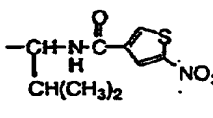

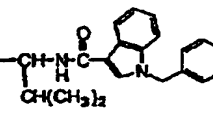
[0159]

Tabl 1.59

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_f \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
639		2	2	1	-	H	
640		2	2	1	-	H	
641		2	2	1	-	H	
642		2	2	1	-	H	
643		2	2	1	-	H	
644		2	2	1	-	H	
645		2	2	1	-	H	
646		2	2	1	-	H	
647		2	2	1	-	H	
648		2	2	1	-	H	
649		2	2	1	-	H	


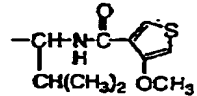
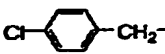
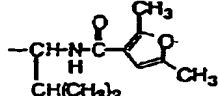
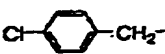
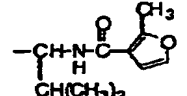

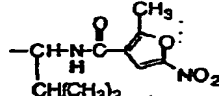

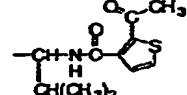

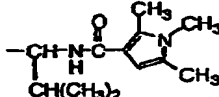

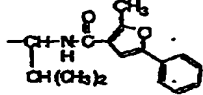

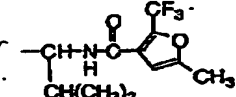
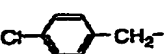
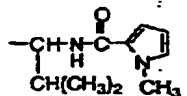
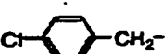
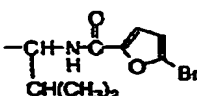

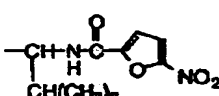
[0 1 6 0]

Table 1.60

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
650		2	2	1	-	H	
651		2	2	1	-	H	
652		2	2	1	-	H	
653		2	2	1	-	H	
654		2	2	1	-	H	
655		2	2	1	-	H	
656		2	2	1	-	H	
657		2	2	1	-	H	
658		2	2	1	-	H	
659		2	2	1	-	H	
660		2	2	1	-	H	

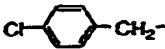
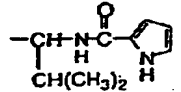

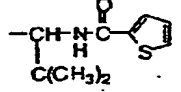

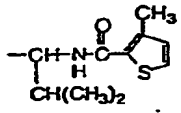
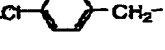
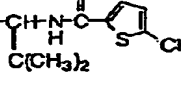

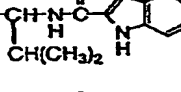

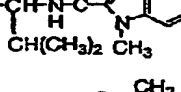
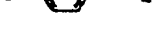
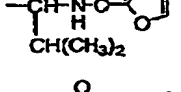

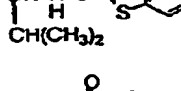

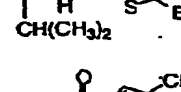

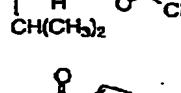

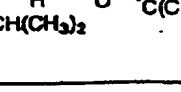
[0161]

Table 1.61

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_1$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
661		2	2	1	-	H	
662		2	2	1	-	H	
663		2	2	1	-	H	
664		2	2	1	-	H	
665		2	2	1	-	H	
666		2	2	1	-	H	
667		2	2	1	-	H	
668		2	2	1	-	H	
669		2	2	1	-	H	
670		2	2	1	-	H	
671		2	2	1	-	H	


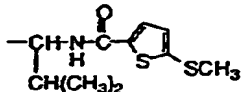

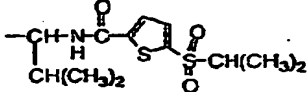
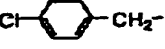
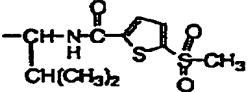
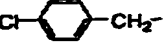
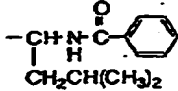

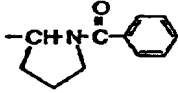
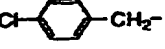
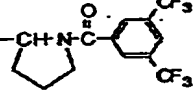
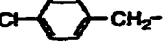
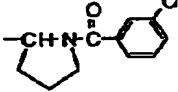
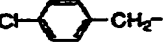
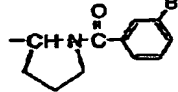

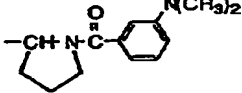

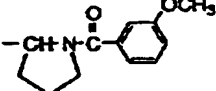

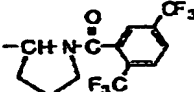
[0162]

Table 1.62

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
672		2	2	1	-	H	
673		2	2	1	-	H	
674		2	2	1	-	H	
675		2	2	1	-	H	
676		2	2	1	-	H	
677		2	2	1	-	H	
678		2	2	1	-	H	
679		2	2	1	-	H	
680		2	2	1	-	H	
681		2	2	1	-	H	
682		2	2	1	-	H	


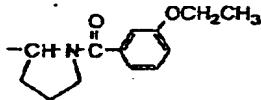
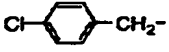
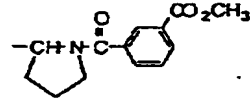
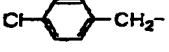
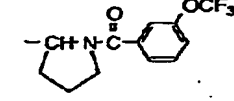

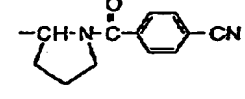

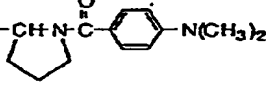
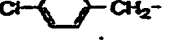
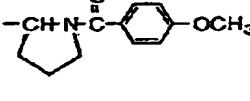

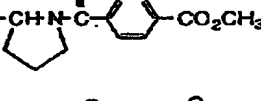
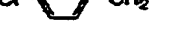
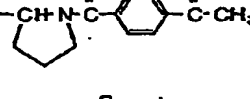

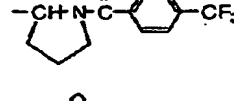
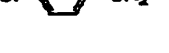
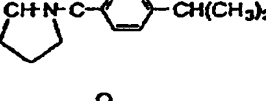
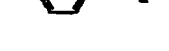
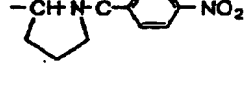
[0 1 6 3]

Table 1.63

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
683		2	2	1	-	H	
684		2	2	1	-	H	
685		2	2	1	-	H	
686		2	2	1	-	H	
687		2	2	1	-	H	
688		2	2	1	-	H	
689		2	2	1	-	H	
690		2	2	1	-	H	
691		2	2	1	-	H	
692		2	2	1	-	H	
693		2	2	1	-	H	


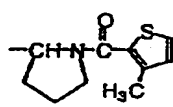

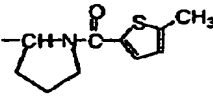

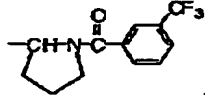

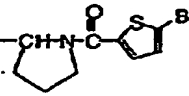

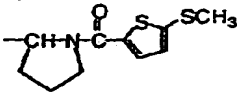
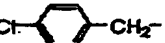
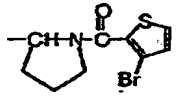

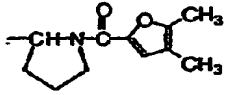

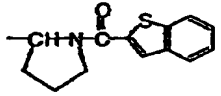

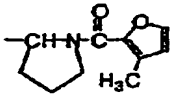
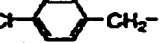
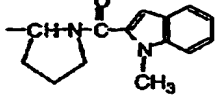

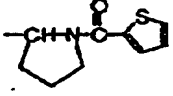
[0 1 6 4]

Table 1.64

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
694		2	2	1	-	H	
695		2	2	1	-	H	
696		2	2	1	-	H	
697		2	2	1	-	H	
698		2	2	1	-	H	
699		2	2	1	-	H	
700		2	2	1	-	H	
701		2	2	1	-	H	
702		2	2	1	-	H	
703		2	2	1	-	H	
704		2	2	1	-	H	

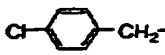
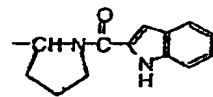
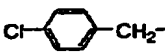
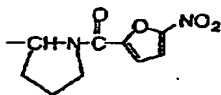
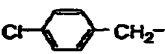
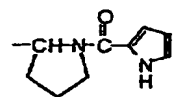
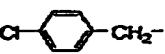
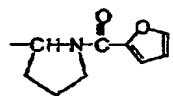
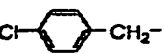
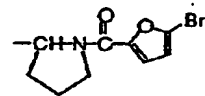
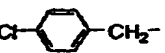
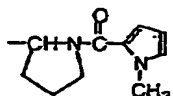
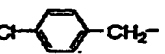
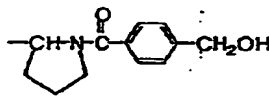
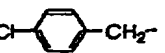
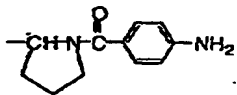
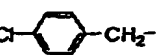
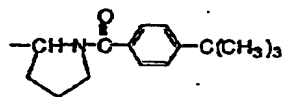
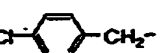
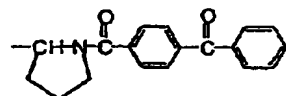
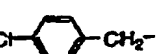
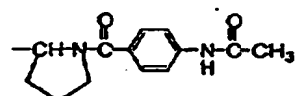
[0165]

Tabl 1.65

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
705		2	2	1	-	H	
706		2	2	1	-	H	
707		2	2	1	-	H	
708		2	2	1	-	H	
709		2	2	1	-	H	
710		2	2	1	-	H	
711		2	2	1	-	H	
712		2	2	1	-	H	
713		2	2	1	-	H	
714		2	2	1	-	H	
715		2	2	1	-	H	

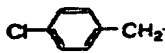
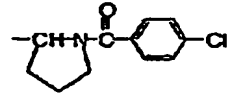
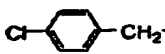
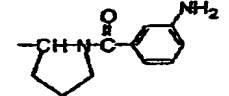
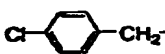
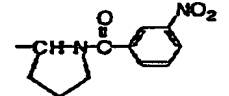
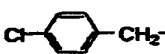
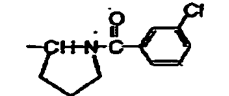

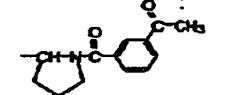
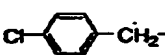
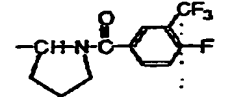

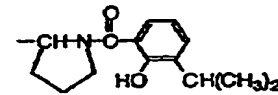

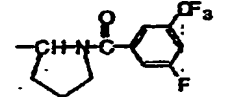
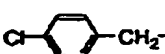
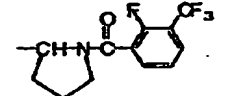
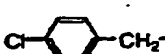
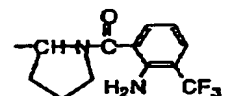
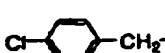
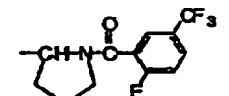
[0 1 6 6]

Table 1.66

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
716		2	2	1	-	H	
717		2	2	1	-	H	
718		2	2	1	-	H	
719		2	2	1	-	H	
720		2	2	1	-	H	
721		2	2	1	-	H	
722		2	2	1	-	H	
723		2	2	1	-	H	
724		2	2	1	-	H	
725		2	2	1	-	H	
726		2	2	1	-	H	


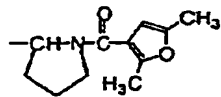
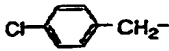
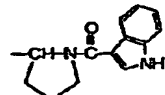
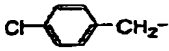
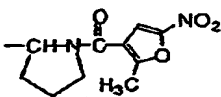

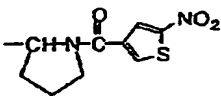
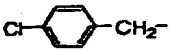
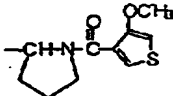

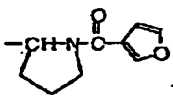
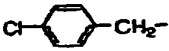
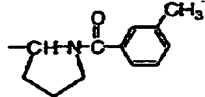
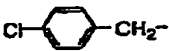
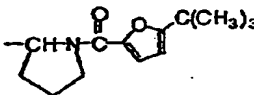

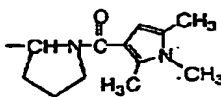
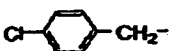
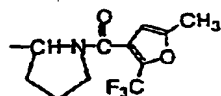

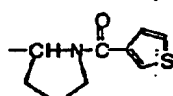
[0167]

Tabl 1.67

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
727		2	2	1	-	H	
728		2	2	1	-	H	
729		2	2	1	-	H	
730		2	2	1	-	H	
731		2	2	1	-	H	
732		2	2	1	-	H	
733		2	2	1	-	H	
734		2	2	1	-	H	
735		2	2	1	-	H	
736		2	2	1	-	H	
737		2	2	1	-	H	


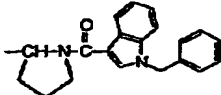

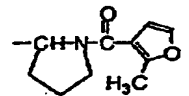
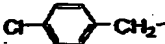
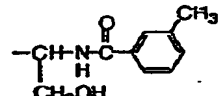
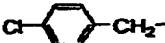
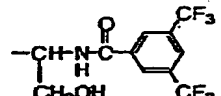

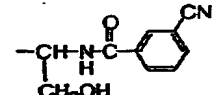

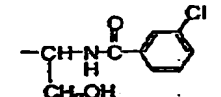

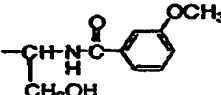
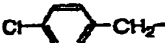
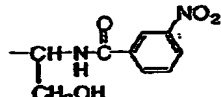

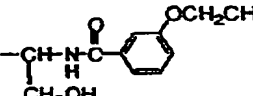

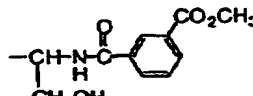

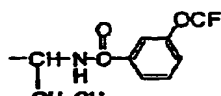
[0168]

Table 1.68

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} - (CH_2)_q - G - R^6$
738		2	2	1	-	H	
739		2	2	1	-	H	
740		2	2	1	-	H	
741		2	2	1	-	H	
742		2	2	1	-	H	
743		2	2	1	-	H	
744		2	2	1	-	H	
745		2	2	1	-	H	
746		2	2	1	-	H	
747		2	2	1	-	H	
748		2	2	1	-	H	

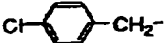
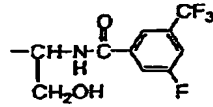

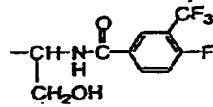

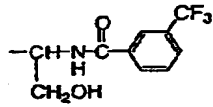

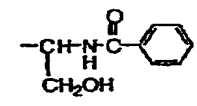

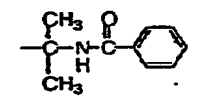

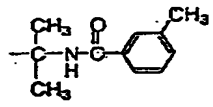

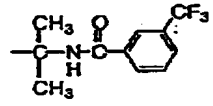

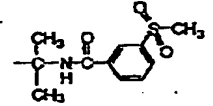

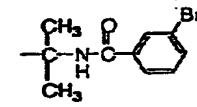

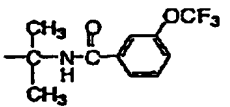

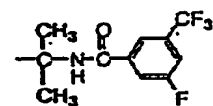
[0169]

Tabl 1.69

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
749		2	2	1	-	H	
750		2	2	1	-	H	
751		2	2	1	-	H	
752		2	2	1	-	H	
753		2	2	1	-	H	
754		2	2	1	-	H	
755		2	2	1	-	H	
756		2	2	1	-	H	
757		2	2	1	-	H	
758		2	2	1	-	H	
759		2	2	1	-	H	


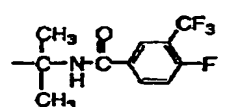
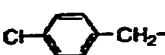
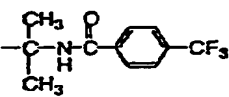
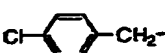
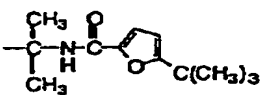
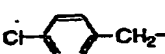
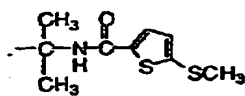
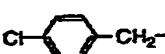
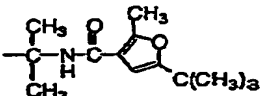

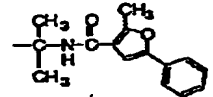
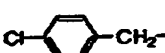
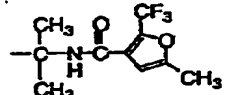

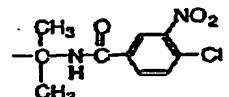

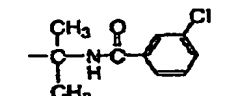

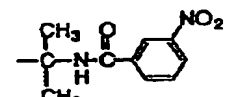

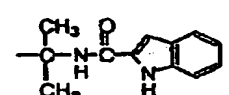
[0170]

Table 1.70

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
760		2	2	1	-	H	
761		2	2	1	-	H	
762		2	2	1	-	H	
763		2	2	1	-	H	
764		2	2	1	-	H	
765		2	2	1	-	H	
766		2	2	1	-	H	
767		2	2	1	-	H	
768		2	2	1	-	H	
769		2	2	1	-	H	
770		2	2	1	-	H	

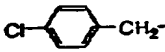
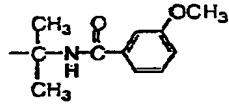
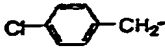
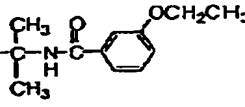
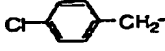
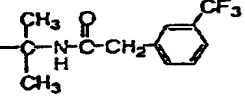
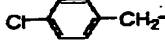
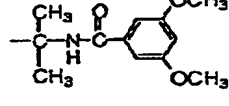

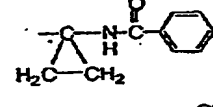

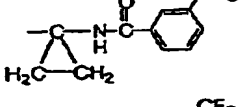

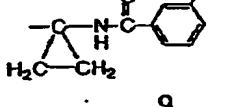

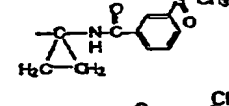
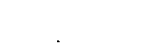
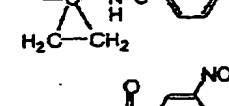

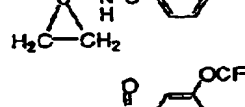

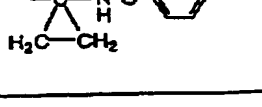
[0171]

Table 1.71

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q -G-R^6$
771		2	2	1	-	H	
772		2	2	1	-	H	
773		2	2	1	-	H	
774		2	2	1	-	H	
775		2	2	1	-	H	
776		2	2	1	-	H	
777		2	2	1	-	H	
778		2	2	1	-	H	
779		2	2	1	-	H	
780		2	2	1	-	H	
781		2	2	1	-	H	

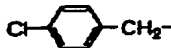
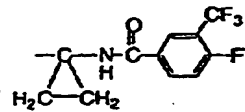

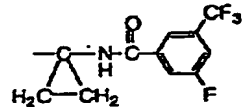

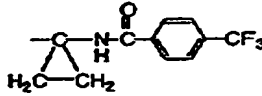

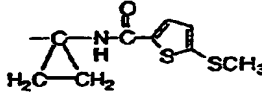

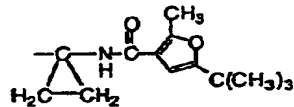

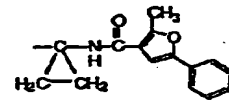

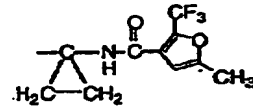

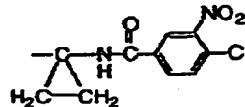
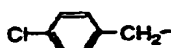
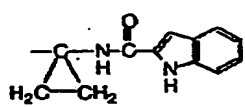

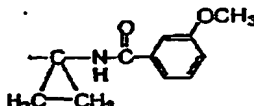

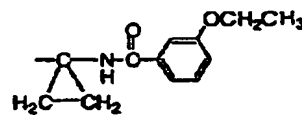
[0172]

Table 1.72

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
782		2	2	1	-	H	
783		2	2	1	-	H	
784		2	2	1	-	H	
785		2	2	1	-	H	
786		2	2	1	-	H	
787		2	2	1	-	H	
788		2	2	1	-	H	
789		2	2	1	-	H	
790		2	2	1	-	H	
791		2	2	1	-	H	
792		2	2	1	-	H	

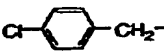
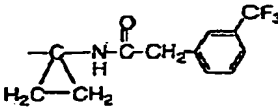
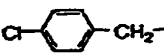
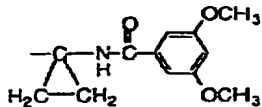
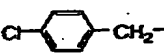
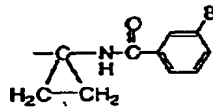

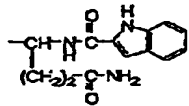

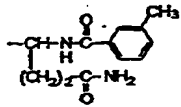
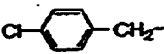
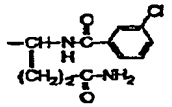
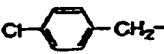
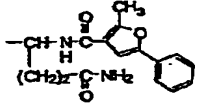
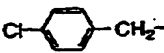
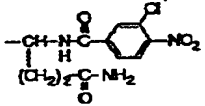
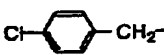
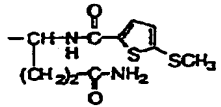

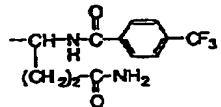

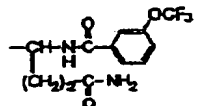
[0 1 7 3]

Tabl 1.73

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} - (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
793		2	2	1	-	H	
794		2	2	1	-	H	
795		2	2	1	-	H	
796		2	2	1	-	H	
797		2	2	1	-	H	
798		2	2	1	-	H	
799		2	2	1	-	H	
800		2	2	1	-	H	
801		2	2	1	-	H	
802		2	2	1	-	H	
803		2	2	1	-	H	


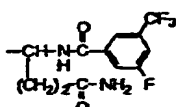

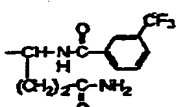
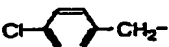
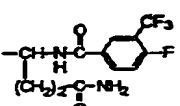

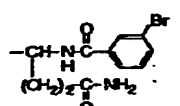
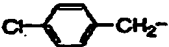
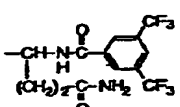
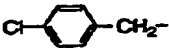
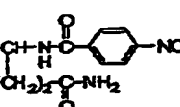
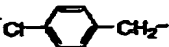
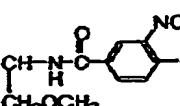

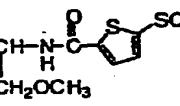
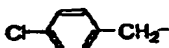
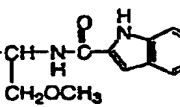

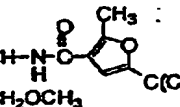

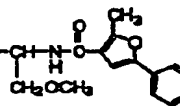
[0174]

Table 1.74

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^5$
804		2	2	1	-	H	
805		2	2	1	-	H	
806		2	2	1	-	H	
807		2	2	1	-	H	
808		2	2	1	-	H	
809		2	2	1	-	H	
810		2	2	1	-	H	
811		2	2	1	-	H	
812		2	2	1	-	H	
813		2	2	1	-	H	
814		2	2	1	-	H	

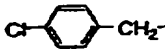
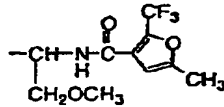

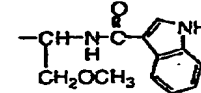

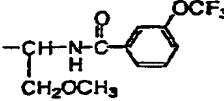
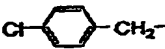
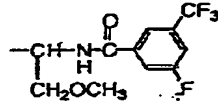
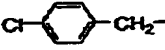
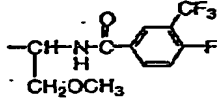

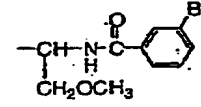
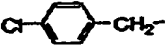
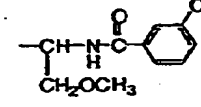
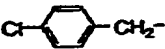
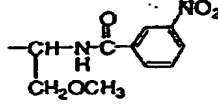

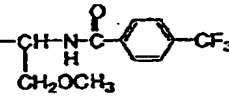

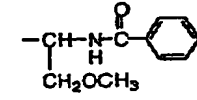

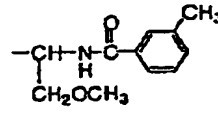
[0175]

Tabl 1.75

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
815		2	2	1	-	H	
816		2	2	1	-	H	
817		2	2	1	-	H	
818		2	2	1	-	H	
819		2	2	1	-	H	
820		2	2	1	-	H	
821		2	2	1	-	H	
822		2	2	1	-	H	
823		2	2	1	-	H	
824		2	2	1	-	H	
825		2	2	1	-	H	

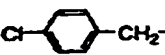
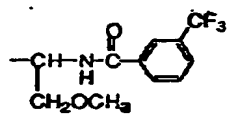
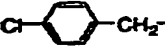
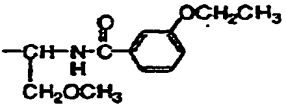
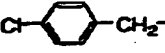
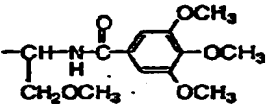
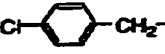
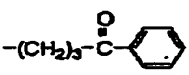

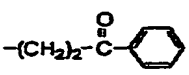

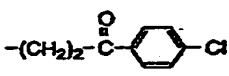
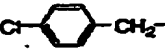
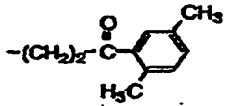
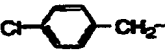
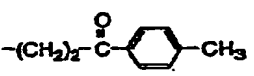
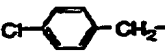
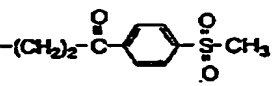

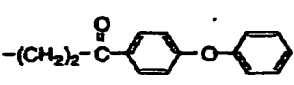
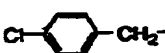
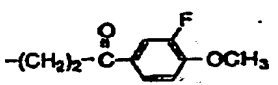
[0 1 7 6]

Table 1.7 6

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_j - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
826		2	2	1	-	H	
827		2	2	1	-	H	
828		2	2	1	-	H	
829		2	2	1	-	H	
830		2	2	1	-	H	
831		2	2	1	-	H	
832		2	2	1	-	H	
833		2	2	1	-	H	
834		2	2	1	-	H	
835		2	2	1	-	H	
836		2	2	1	-	H	


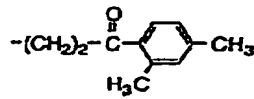
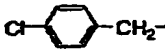
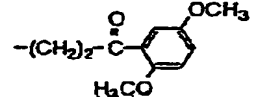

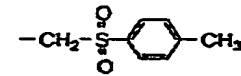

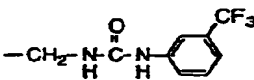

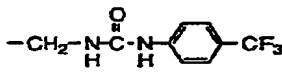

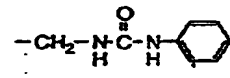

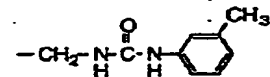
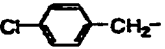
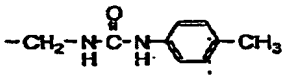

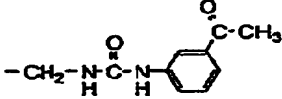
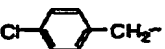
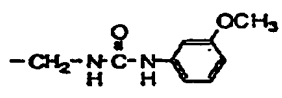

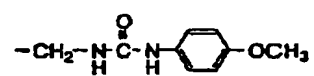
[0 1 7 7]

Tabl 1.77

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
837		2	2	1	-	H	
838		2	2	1	-	H	
839		2	2	1	-	H	
840		2	2	1	-	H	
841		2	2	1	-	H	
842		2	2	1	-	H	
843		2	2	1	-	H	
844		2	2	1	-	H	
845		2	2	1	-	H	
846		2	2	1	-	H	
847		2	2	1	-	H	


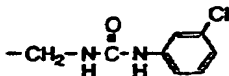

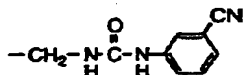
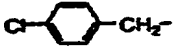
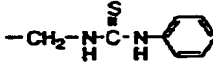

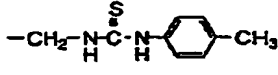
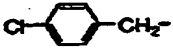
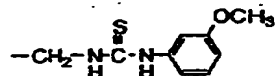
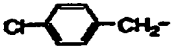
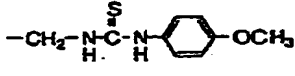
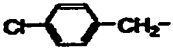
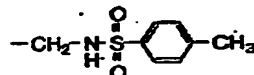

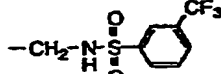

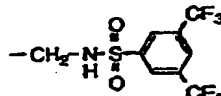
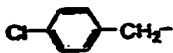
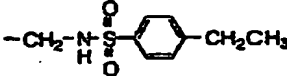
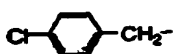
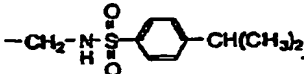
【0178】

Table 1.78

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
848		2	2	1	-	H	
849		2	2	1	-	H	
850		2	2	1	-	H	
851		2	2	1	-	H	
852		2	2	1	-	H	
853		2	2	1	-	H	
854		2	2	1	-	H	
855		2	2	1	-	H	
856		2	2	1	-	H	
857		2	2	1	-	H	
858		2	2	1	-	H	

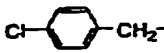
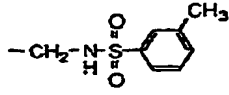
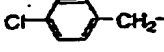
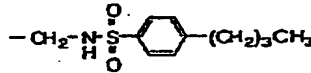
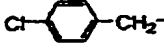
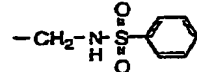

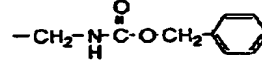
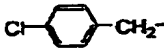
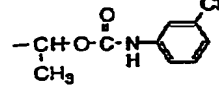
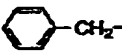
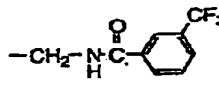

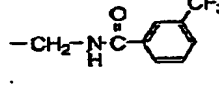

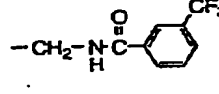

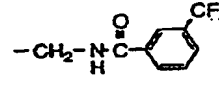
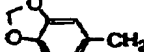
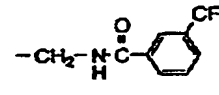
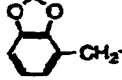
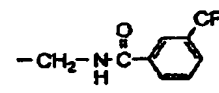
[0 1 7 9]

Tabl 1.79

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ C \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - R^6$
859		2	2	1	-	H	
860		2	2	1	-	H	
861		2	2	1	-	H	
862		2	2	1	-	H	
863		2	2	1	-	H	
864		2	2	1	-	H	
865		2	2	1	-	H	
866		2	2	1	-	H	
867		2	2	1	-	H	
868		2	2	1	-	H	
869		2	2	1	-	H	

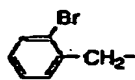
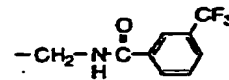
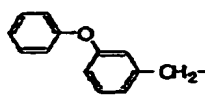
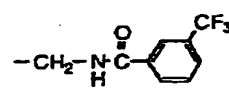
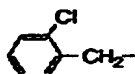
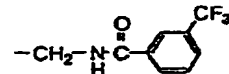
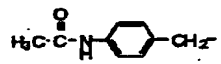
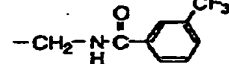
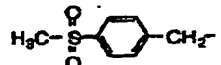
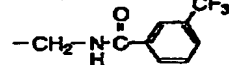

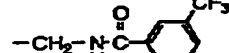
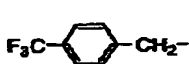
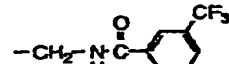

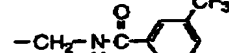
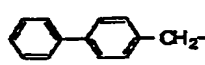
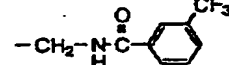
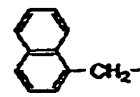
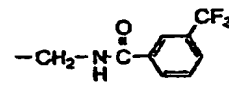
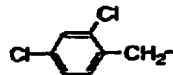
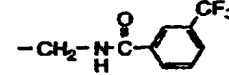
[0180]

Tabl 1.80

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
870		2	2	1	-	H	
871		2	2	1	-	H	
872		2	2	1	-	H	
873		2	2	1	-	H	
874		2	2	1	-	H	
875		2	2	1	-	H	
876		2	2	1	-	H	
877		2	2	1	-	H	
878		2	2	1	-	H	
879		2	2	1	-	H	
880		2	2	1	-	H	

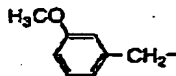
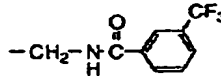
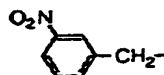
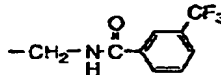
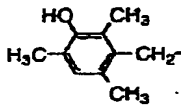
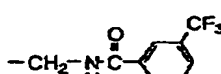
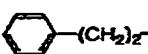
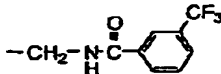
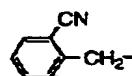
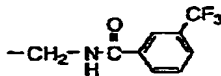
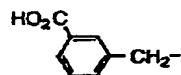
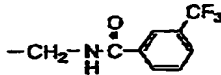

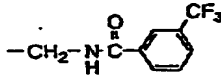
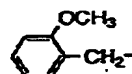
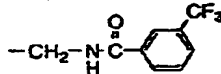
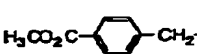
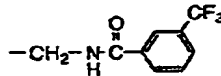
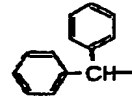
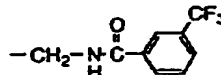
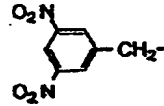
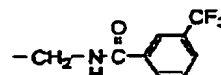
[0181]

Tabl 1.81

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
881		2	2	1	-	H	
882		2	2	1	-	H	
883		2	2	1	-	H	
884		2	2	1	-	H	
885		2	2	1	-	H	
886		2	2	1	-	H	
887		2	2	1	-	H	
888		2	2	1	-	H	
889		2	2	1	-	H	
890		2	2	1	-	H	
891		2	2	1	-	H	

【0182】

Tabl 1.82

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_r - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
892		2	2	1	-	H	
893		2	2	1	-	H	
894		2	2	1	-	H	
895		2	2	1	-	H	
896		2	2	1	-	H	
897		2	2	1	-	H	
898		2	2	1	-	H	
899		2	2	1	-	H	
900		2	2	1	-	H	
901		2	2	1	-	H	
902		2	2	1	-	H	

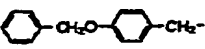
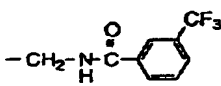
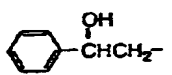
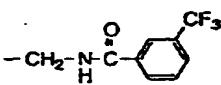
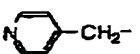
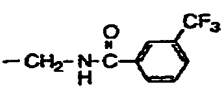
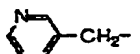
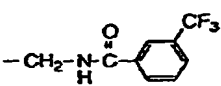
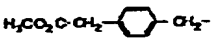
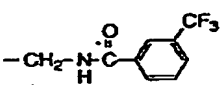
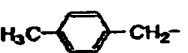
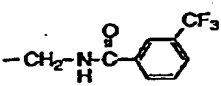
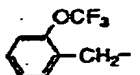
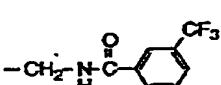
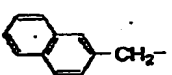
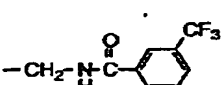
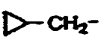
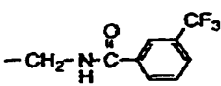
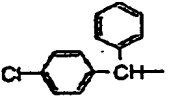
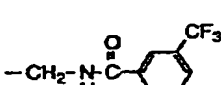
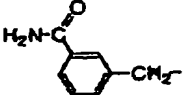
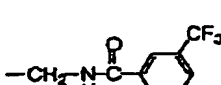
[0183]

Tabl 1.83

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
903		2	2	1	-	H	
904		2	2	1	-	H	
905		2	2	1	-	H	
906		2	2	1	-	H	
907		2	2	1	-	H	
908		2	2	1	-	H	
909		2	2	1	-	H	
910		2	2	1	-	H	
911		2	2	1	-	H	
912		2	2	1	-	H	
913		2	2	1	-	H	

【0 1 8 4】

Table 1.84

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - R^6$
914		2	2	1	-	H	
915		2	2	1	-	H	
916		2	2	1	-	H	
917		2	2	1	-	H	
918		2	2	1	-	H	
919		2	2	1	-	H	
920		2	2	1	-	H	
921		2	2	1	-	H	
922		2	2	1	-	H	
923		2	2	1	-	H	
924		2	2	1	-	H	

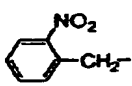
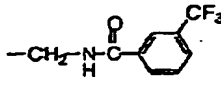
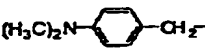
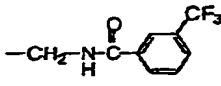
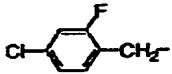
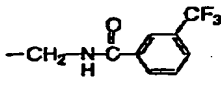
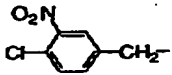
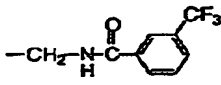
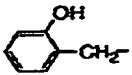
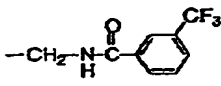
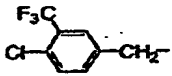
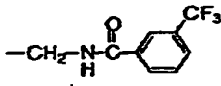
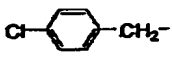
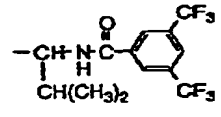
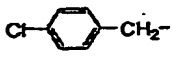
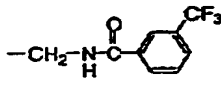

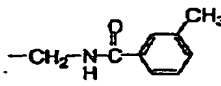
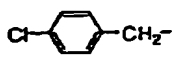
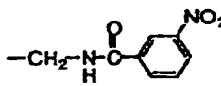
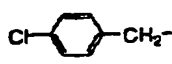
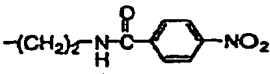
[0185]

Table 1.85

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
925	$H_2N-C(=O)-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
926	$C_6H_5-CH_2-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
927	$F_3CO-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	;	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
928	$F_3CO-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
929	$H_2CS-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
930	$CH_3-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
931	$NC-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
932	$Cl-C_6H_3(NO_2)-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
933	$CH_3-CH-C_6H_5$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
934	$C_5H_5N-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
935	$O_2N-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$


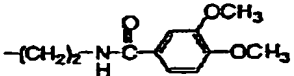
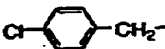
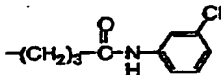
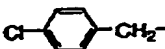
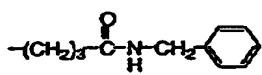

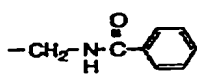
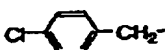
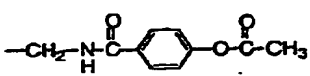
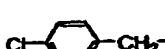
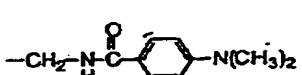

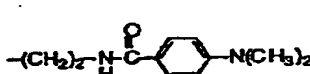
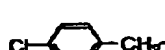
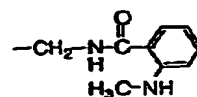

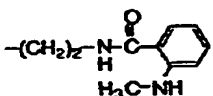

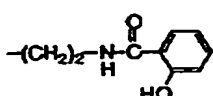

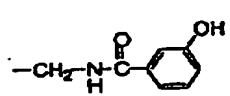
[0186]

Table 1.86

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
936		2	2	1	-	H	
937		2	2	1	-	H	
938		2	2	1	-	H	
939		2	2	1	-	H	
940		2	2	1	-	H	
941		2	2	1	-	H	
942		2	2	1	-	H	
943		1	4	0	-	H	
944		1	4	0	-	H	
945		1	4	0	-	H	
946		1	4	0	-	H	

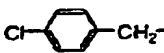
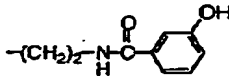
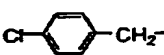
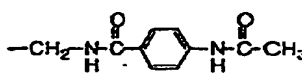

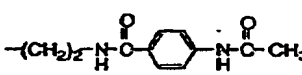

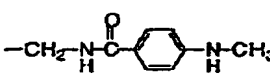

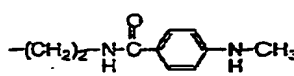
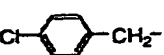
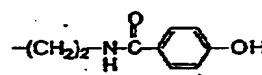
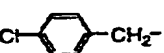
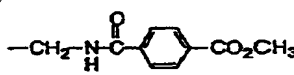

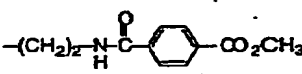
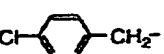
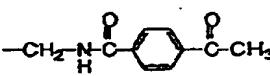
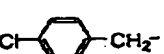
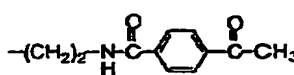

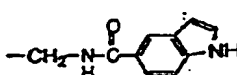
【 0 1 8 7 】

Tabl 1.87

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
947		1	4	0	-	H	
948		1	4	0	-	H	
949		1	4	0	-	H	
950		0	4	1	-	H	
951		1	2	0	R	H	
952		1	2	0	R	H	
953		1	2	0	R	H	
954		1	2	0	R	H	
955		1	2	0	R	H	
956		1	2	0	R	H	
957		1	2	0	R	H	


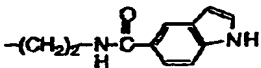

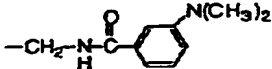

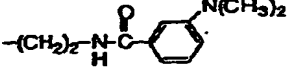

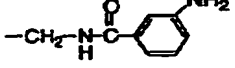

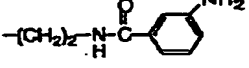
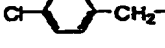
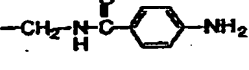
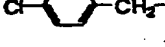
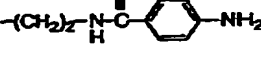



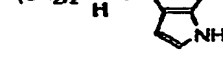

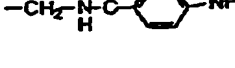

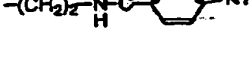
【0 1 8 8】

Tabl 1.88

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_f \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
958		1	2	0	R	H	
959		1	2	0	R	H	
960		1	2	0	R	H	
961		1	2	0	R	H	
962		1	2	0	R	H	
963		1	2	0	R	H	
964		1	2	0	R	H	
965		1	2	0	R	H	
966		1	2	0	R	H	
967		1	2	0	R	H	
968		1	2	0	R	H	

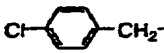
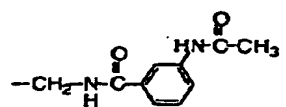
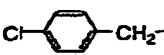
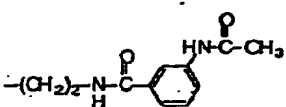

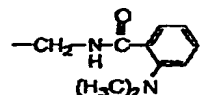
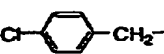
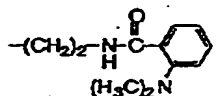
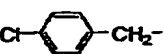
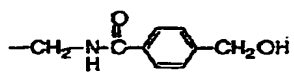

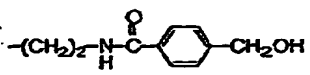
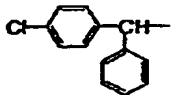
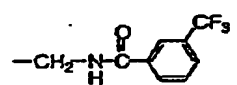
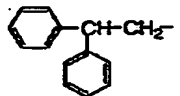
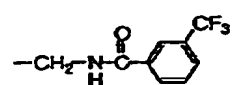
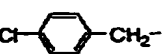
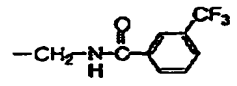
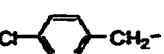
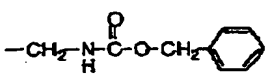

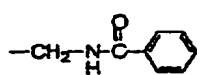
[0 1 8 9]

Tabl 1.89

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
969		1	2	0	R	H	
970		1	2	0	R	H	
971		1	2	0	R	H	
972		1	2	0	R	H	
973		1	2	0	R	H	
974		1	2	0	R	H	
975		1	2	0	R	H	
976		1	2	0	R	H	
977		1	2	0	R	H	
978		1	2	0	R	H	
979		1	2	0	R	H	

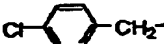
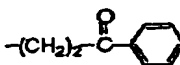

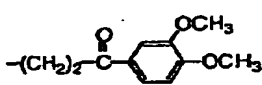

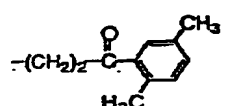

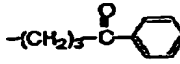

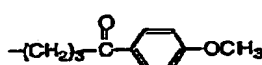

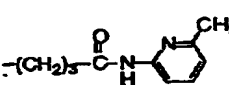

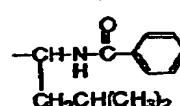

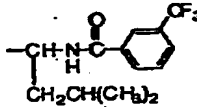

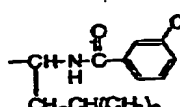

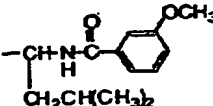

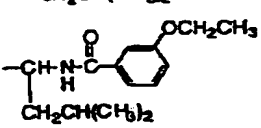
【0190】

Table 1.90

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
980		1	2	0	R	H	
981		1	2	0	R	H	
982		1	2	0	R	H	
983		1	2	0	R	H	
984		1	2	0	R	H	
985		1	2	0	R	H	
986		1	2	0	R	H	
987		2	2	1	-	H	
988		1	4	0	-	H	
989		1	4	0	-	H	
990		1	4	0	-	H	

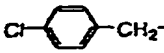
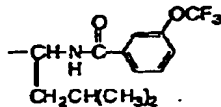
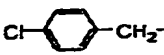
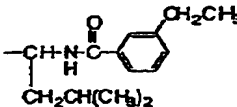
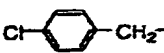
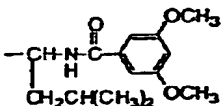
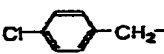
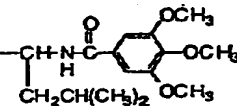

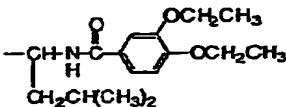
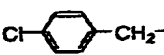
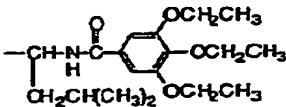

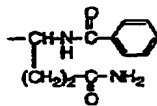
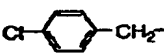
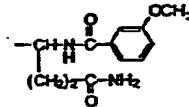

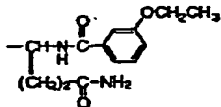
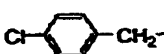
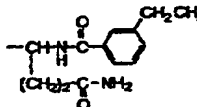

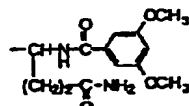
【0191】

Tabl 1.91

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_f \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
991		1	4	0	-	H	
992		1	4	0	-	H	
993		1	4	0	-	H	
994		1	4	0	-	H	
995		1	4	0	-	H	
996		1	4	0	-	H	
997		2	2	1	-	H	
998		2	2	1	-	H	
999		2	2	1	-	H	
1000		2	2	1	-	H	
1001		2	2	1	-	H	


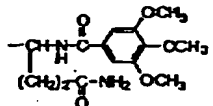

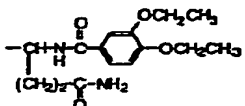
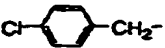
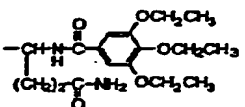

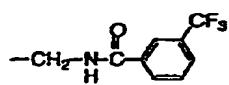

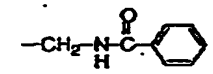
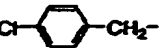
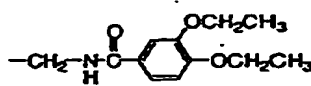

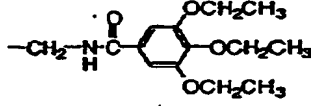

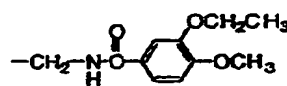
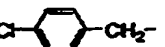
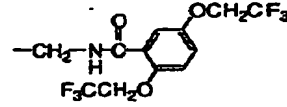

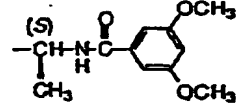
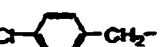
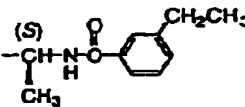
[0192]

Table 1.92

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_j - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1002		2	2	1	-	H	
1003		2	2	1	-	H	
1004		2	2	1	-	H	
1005		2	2	1	-	H	
1006		2	2	1	-	H	
1007		2	2	1	-	H	
1008		2	2	1	-	H	
1009		2	2	1	-	H	
1010		2	2	1	-	H	
1011		2	2	1	-	H	
1012		2	2	1	-	H	


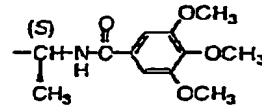
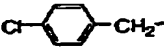
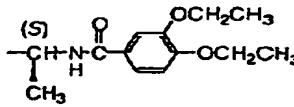
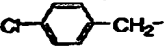
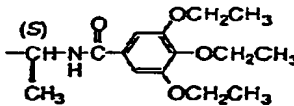
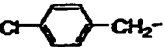
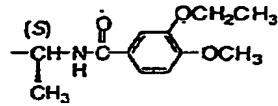
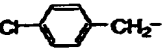
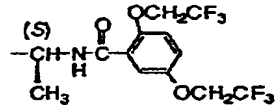

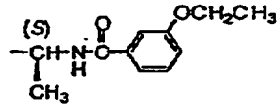
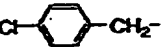
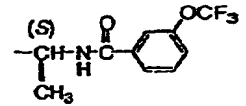

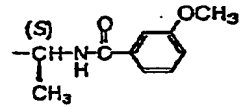

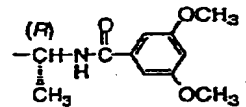
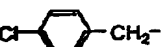
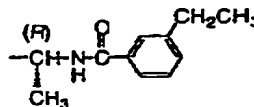

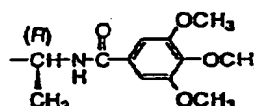
[0193]

Table 1.93

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1013		2	2	1	-	H	
1014		2	2	1	-	H	
1015		2	2	1	-	H	
1016		2	2	0	-	H	
1017		2	2	0	-	H	
1018		2	2	1	-	H	
1019		2	2	1	-	H	
1020		2	2	1	-	H	
1021		2	2	1	-	H	
1022		2	2	1	-	H	
1023		2	2	1	-	H	


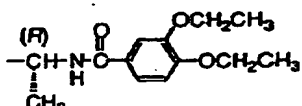
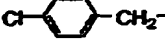
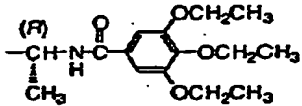

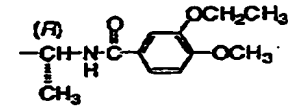

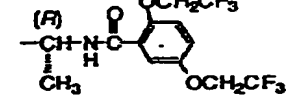

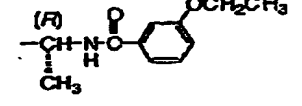

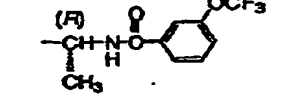

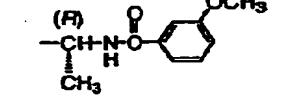

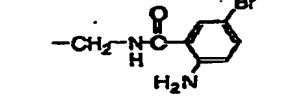

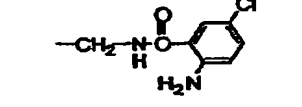

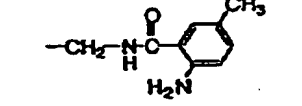

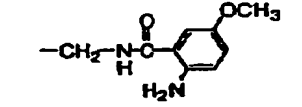
[0 1 9 4]

Table 1.94

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1024		2	2	1	-	H	
1025		2	2	1	-	H	
1026		2	2	1	-	H	
1027		2	2	1	-	H	
1028		2	2	1	-	H	
1029		2	2	1	-	H	
1030		2	2	1	-	H	
1031		2	2	1	-	H	
1032		2	2	1	-	H	
1033		2	2	1	-	H	
1034		2	2	1	-	H	

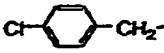
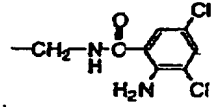

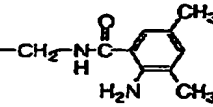
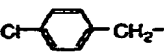
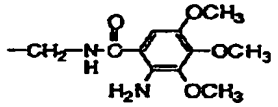
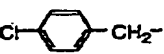
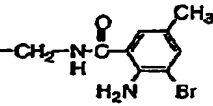
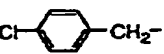
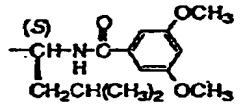
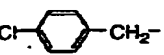
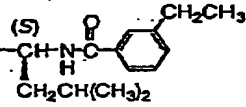
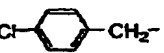
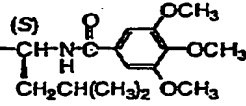
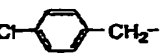
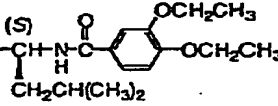
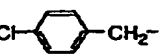
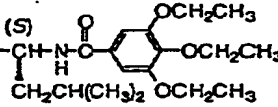
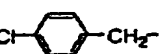
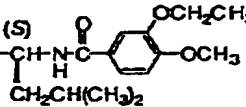
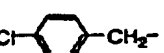
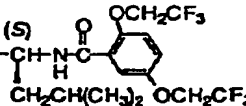
[0195]

Table 1.95

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1035		2	2	1	-	H	
1036		2	2	1	-	H	
1037		2	2	1	-	H	
1038		2	2	1	-	H	
1039		2	2	1	-	H	
1040		2	2	1	-	H	
1041		2	2	1	-	H	
1042		2	2	1	-	H	
1043		2	2	1	-	H	
1044		2	2	1	-	H	
1045		2	2	1	-	H	


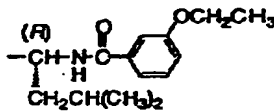
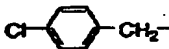
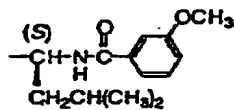

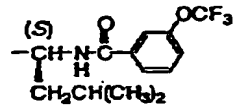

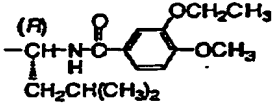

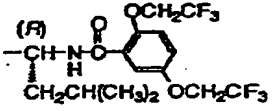
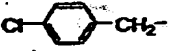
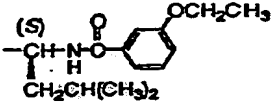
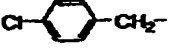
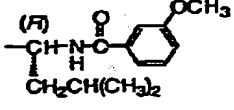

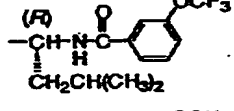
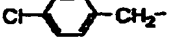
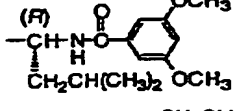

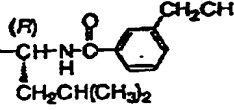

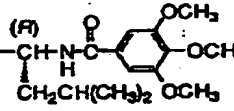
[0196]

Table 1.96

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - R^6$
1046		2	2	1	-	H	
1047		2	2	1	-	H	
1048		2	2	1	-	H	
1049		2	2	1	-	H	
1050		2	2	1	-	H	
1051		2	2	1	-	H	
1052		2	2	1	-	H	
1053		2	2	1	-	H	
1054		2	2	1	-	H	
1055		2	2	1	-	H	
1056		2	2	1	-	H	

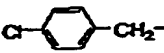
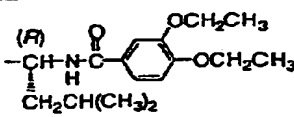
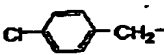
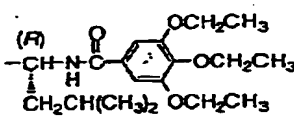

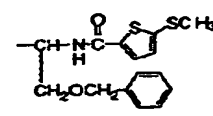
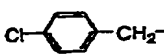
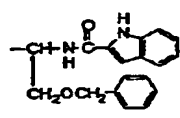
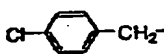
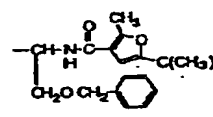

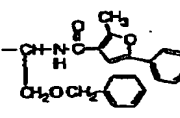

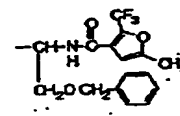
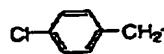
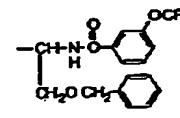

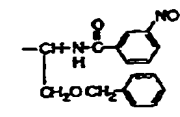

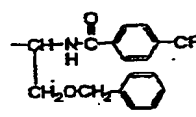

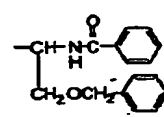
[0197]

Tabl 1.97

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1057		2	2	1	-	H	
1058		2	2	1	-	H	
1059		2	2	1	-	H	
1060		2	2	1	-	H	
1061		2	2	1	-	H	
1062		2	2	1	-	H	
1063		2	2	1	-	H	
1064		2	2	1	-	H	
1065		2	2	1	-	H	
1066		2	2	1	-	H	
1067		2	2	1	-	H	


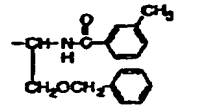

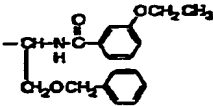

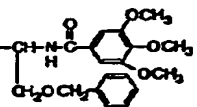

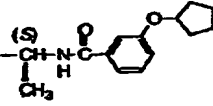

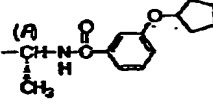
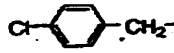
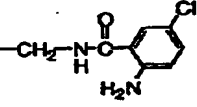

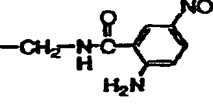

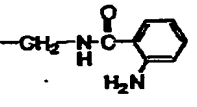

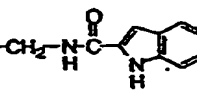

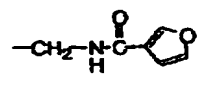

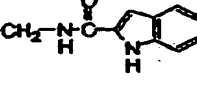
[0198]

Table 1.98

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j- \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
1068		2	2	1	-	H	
1069		2	2	1	-	H	
1070		2	2	1	-	H	
1071		2	2	1	-	H	
1072		2	2	1	-	H	
1073		2	2	1	-	H	
1074		2	2	1	-	H	
1075		2	2	1	-	H	
1076		2	2	1	-	H	
1077		2	2	1	-	H	
1078		2	2	1	-	H	

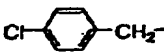
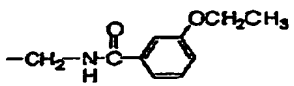

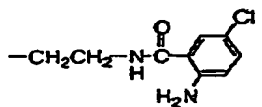
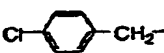
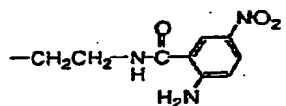

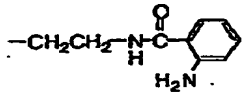

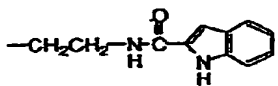
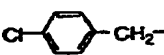
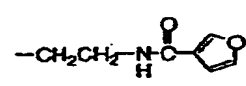

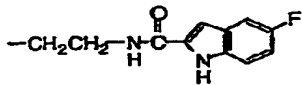
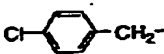
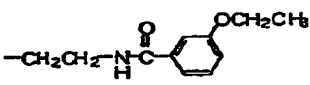

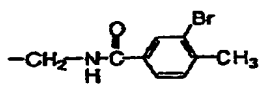
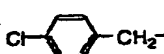
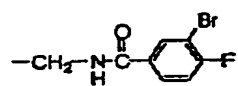

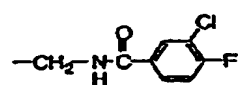
[0199]

Tabl 1.99

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q-G-R^6$
1079		2	2	1	-	H	
1080		2	2	1	-	H	
1081		2	2	1	-	H	
1082		2	2	1	-	H	
1083		2	2	1	-	H	
1084		1	2	0	R	H	
1085		1	2	0	R	H	
1086		1	2	0	R	H	
1087		1	2	0	R	H	
1088		1	2	0	R	H	
1089		1	2	0	R	H	


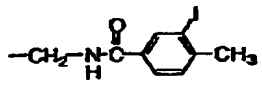

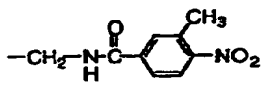

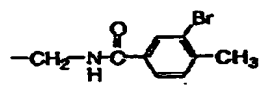

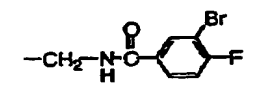

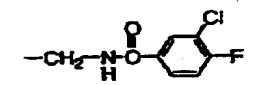

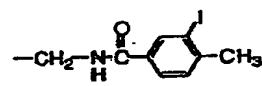
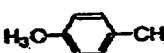
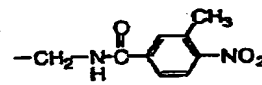
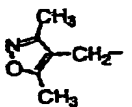
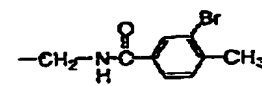
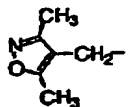
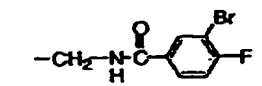
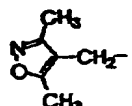
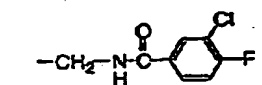
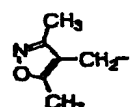
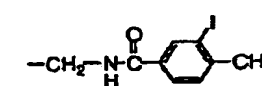
[0200]

Tabl 1.100

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1090		1	2	0	R	H	
1091		1	2	0	R	H	
1092		1	2	0	R	H	
1093		1	2	0	R	H	
1094		1	2	0	R	H	
1095		1	2	0	R	H	
1096		1	2	0	R	H	
1097		1	2	0	R	H	
1098		1	2	0	R	H	
1099		1	2	0	R	H	
1100		1	2	0	R	H	

[0201]

Table 1.101

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
1101		1	2	0	R	H	
1102		1	2	0	R	H	
1103		1	2	0	R	H	
1104		1	2	0	R	H	
1105		1	2	0	R	H	
1106		1	2	0	R	H	
1107		1	2	0	R	H	
1108		1	2	0	R	H	
1109		1	2	0	R	H	
1110		1	2	0	R	H	
1111		1	2	0	R	H	

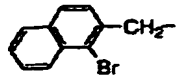
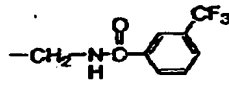
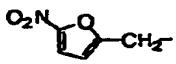
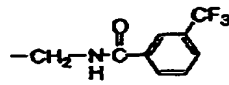
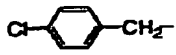
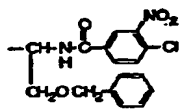
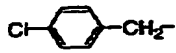
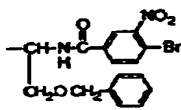
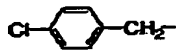
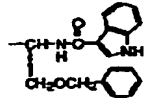
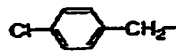
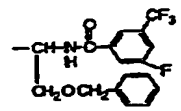
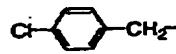
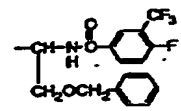

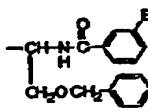
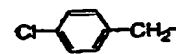
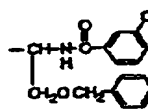

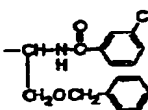
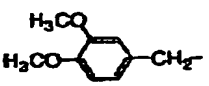
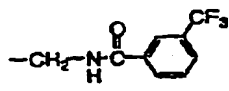
[0202]

Table 1.102

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q -G-R^6$
1112		1	2	0	R	H	
1113		2	2	1	-	H	
1114		2	2	1	-	H	
1115		2	2	1	-	H	
1116		2	2	1	-	H	
1117		2	2	1	-	H	
1118		1	2	0	R	H	
1119		1	2	0	R	H	
1120		1	2	0	R	H	
1121		1	2	0	R	H	
1122		1	2	0	R	H	

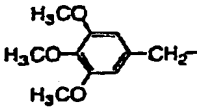
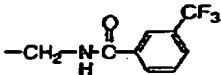
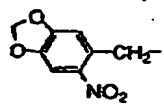
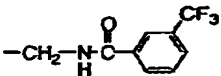
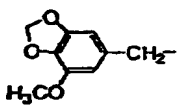
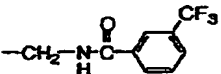
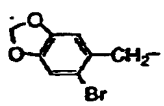
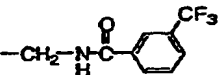
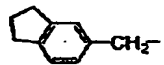
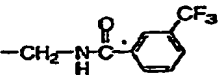
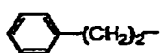
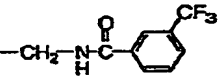
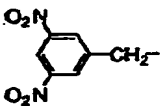
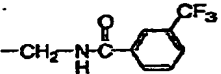
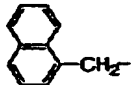
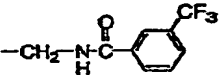
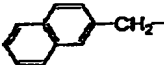
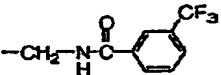
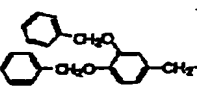
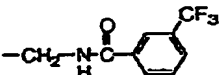
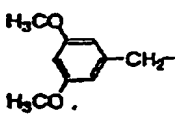
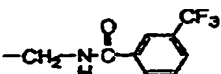
[0203]

Tabl 1.103

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^5	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1123		1	2	0	R	H	
1124		1	2	0	R	H	
1125		2	2	1	-	H	
1126		2	2	1	-	H	
1127		2	2	1	-	H	
1128		2	2	1	-	H	
1129		2	2	1	-	H	
1130		2	2	1	-	H	
1131		2	2	1	-	H	
1132		2	2	1	-	H	
1133		1	2	0	R	H	

【 0 2 0 4 】

Table 1.104

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1134		1	2	0	R	H	
1135		1	2	0	R	H	
1136		1	2	0	R	H	
1137		1	2	0	R	H	
1138		1	2	0	R	H	
1139		1	2	0	R	H	
1140		1	2	0	R	H	
1141		1	2	0	R	H	
1142		1	2	0	R	H	
1143		1	2	0	R	H	
1144		1	2	0	R	H	

[0205]

Table 1.105

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q \\ \\ R^5 \end{array} -G-R^6$
1145		1	2	0	R	H	
1146		1	2	0	R	H	
1147		1	2	0	R	H	
1148		1	2	0	R	H	
1149		1	2	0	R	H	
1150		1	2	0	R	H	
1151		1	2	0	R	H	
1152		1	2	0	R	H	
1153		1	2	0	R	H	
1154		1	2	0	R	H	
1155		1	2	0	R	H	

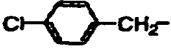
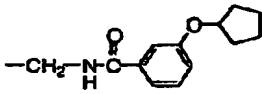
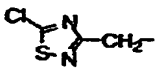
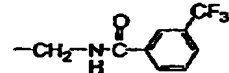
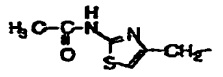
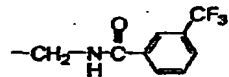
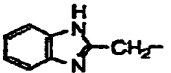
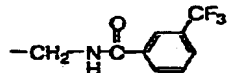
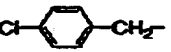
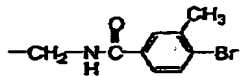
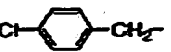
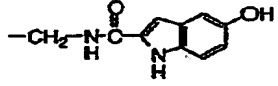
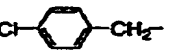
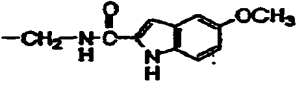
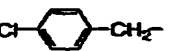
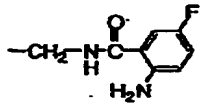

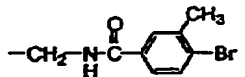

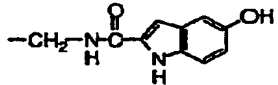

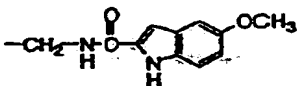
[0206]

Table 1.106

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1156		1	2	0	R	H	
1157		1	2	0	R	H	
1158		1	2	0	R	H	
1159		1	2	0	R	H	
1160		1	2	0	R	H	
1161		1	2	0	R	H	
1162		1	2	0	R	H	
1163		1	2	0	R	H	
1164		1	2	0	R	H	
1165		1	2	0	R	H	
1166		1	2	0	R	H	


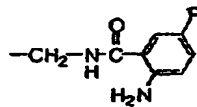

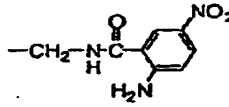

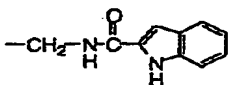
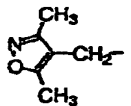
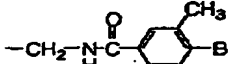
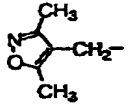
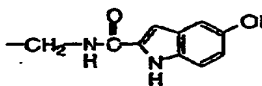
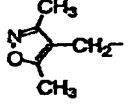
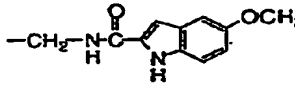
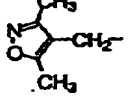
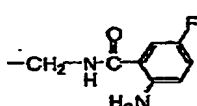
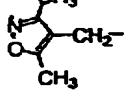
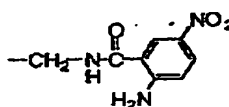
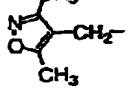
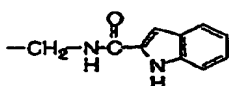
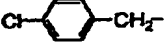
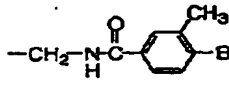

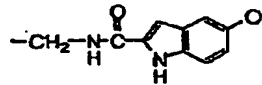
[0207]

Table 1.107

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1167		2	2	1	-	H	
1168		1	2	0	R	H	
1169		1	2	0	R	H	
1170		1	2	0	R	H	
1171		1	2	0	R	H	
1172		1	2	0	R	H	
1173		1	2	0	R	H	
1174		1	2	0	R	H	
1175		1	2	0	R	H	
1176		1	2	0	R	H	
1177		1	2	0	R	H	

[0208]

Table 1.108

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1178		1	2	0	R	H	
1179		1	2	0	R	H	
1180		1	2	0	R	H	
1181		1	2	0	R	H	
1182		1	2	0	R	H	
1183		1	2	0	R	H	
1184		1	2	0	R	H	
1185		1	2	0	R	H	
1186		1	2	0	R	H	
1187		2	2	1	-	H	
1188		2	2	1	-	H	

[0209]

Table 1.109

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1189		2	2	1	-	H	
1190		2	2	1	-	H	
1191		1	2	0	R	H	
1192		1	2	0	R	H	
1193		1	2	0	R	H	
1194		1	2	0	R	H	
1195		1	2	0	R	H	
1196		1	2	0	R	H	
1197		1	2	0	R	H	
1198		1	2	0	R	H	
1199		1	2	0	R	H	


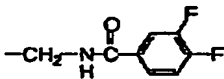

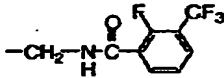
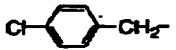
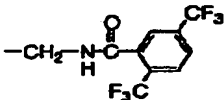
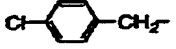
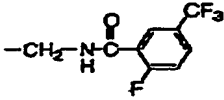
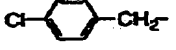
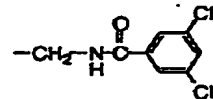

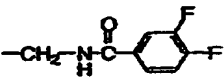

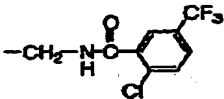
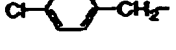
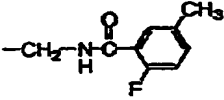
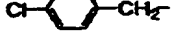
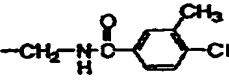
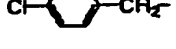
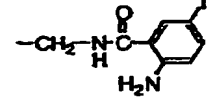
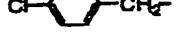
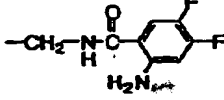
[0 2 1 0]

Table 1.110

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_j - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1200		1	2	0	R	H	
1201		1	2	0	R	H	
1202		1	2	0	R	H	
1203		1	2	0	R	H	
1204		1	2	0	R	H	
1205		1	2	0	R	H	
1206		1	2	0	R	H	
1207		1	2	0	R	H	
1208		1	2	0	R	H	
1209		1	2	0	R	H	
1210		1	2	0	R	H	

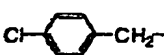
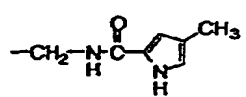

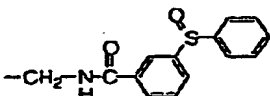
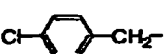
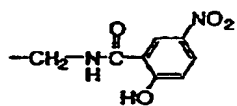
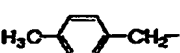
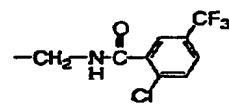
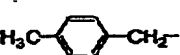
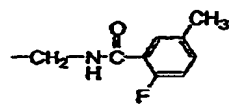
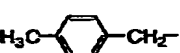
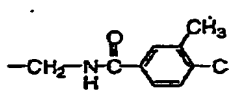
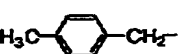
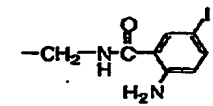
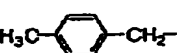
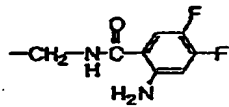
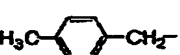
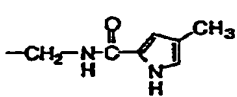

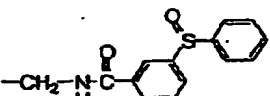

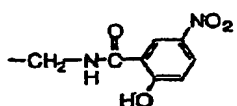
[0211]

Table 1.111

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - R^6$
1211		1	2	0	R	H	
1212		1	2	0	R	H	
1213		2	2	1	-	H	
1214		2	2	1	-	H	
1215		2	2	1	-	H	
1216		2	2	1	-	H	
1217		1	2	0	R	H	
1218		1	2	0	R	H	
1219		1	2	0	R	H	
1220		1	2	0	R	H	
1221		1	2	0	R	H	

[0 2 1 2]

Table 1.112

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
1222		1	2	0	R	H	
1223		1	2	0	R	H	
1224		1	2	0	R	H	
1225		1	2	0	R	H	
1226		1	2	0	R	H	
1227		1	2	0	R	H	
1228		1	2	0	R	H	
1229		1	2	0	R	H	
1230		1	2	0	R	H	
1231		1	2	0	R	H	
1232		1	2	0	R	H	

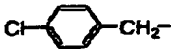
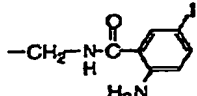

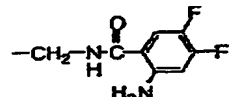

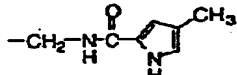

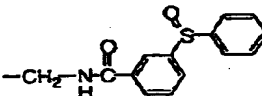

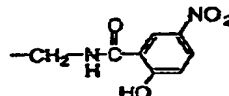
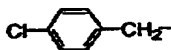
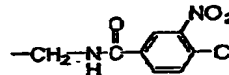

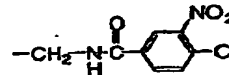
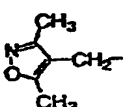
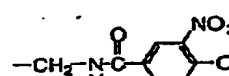

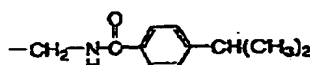

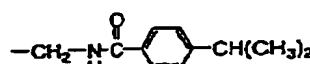
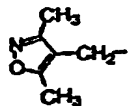
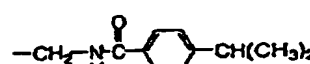
[0213]

Table 1.113

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
1233		1	2	0	R	H	
1234		1	2	0	R	H	
1235		1	2	0	R	H	
1236		1	2	0	R	H	
1237		1	2	0	R	H	
1238		1	2	0	R	H	
1239		1	2	0	R	H	
1240		1	2	0	R	H	
1241		2	2	1	-	H	
1242		2	2	1	-	H	
1243		2	2	1	-	H	

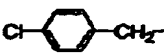
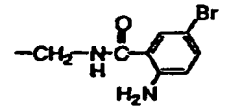
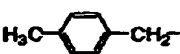
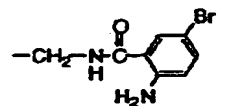
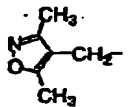
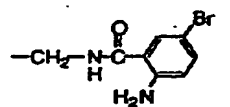
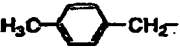
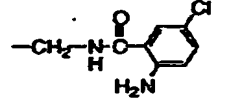
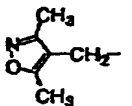
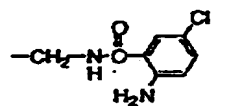
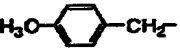
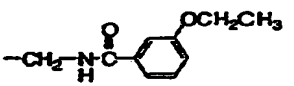
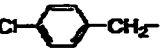
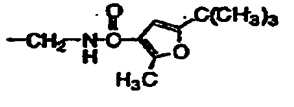
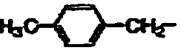
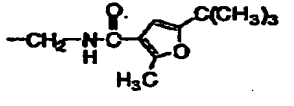
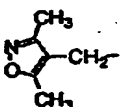
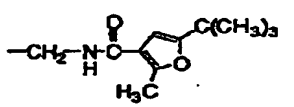
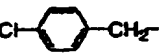
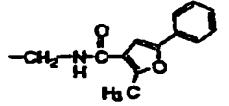
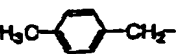
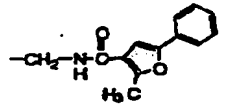
[0214]

Tabl 1.114

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1244		2	2	1	-	H	
1245		2	2	1	-	H	
1246		2	2	1	-	H	
1247		2	2	1	-	H	
1248		2	2	1	-	H	
1249		1	2	0	R	H	
1250		1	2	0	R	H	
1251		1	2	0	R	H	
1252		1	2	0	R	H	
1253		1	2	0	R	H	
1254		1	2	0	R	H	

[0215]

Tabl 1.115

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1255		1	2	0	R	H	
1256		1	2	0	R	H	
1257		1	2	0	R	H	
1258		1	2	0	R	H	
1259		1	2	0	R	H	
1260		1	2	0	R	H	
1261		1	2	0	R	H	
1262		1	2	0	R	H	
1263		1	2	0	R	H	
1264		1	2	0	R	H	
1265		1	2	0	R	H	

[0216]

Table 1.116

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1266		1	2	0	R	H	
1267		1	2	0	R	H	
1268		1	2	0	R	H	
1269		1	2	0	R	H	
1270		1	2	0	R	H	
1271		1	2	0	R	H	
1272		1	2	0	R	H	
1273		1	2	0	R	H	
1274		1	2	0	R	H	
1275		1	2	0	R	H	
1276		1	2	0	R	H	

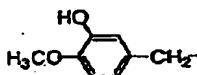
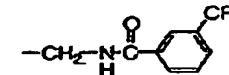
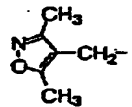
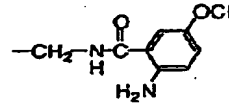
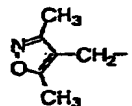
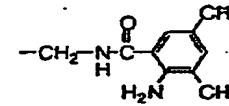
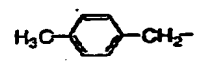
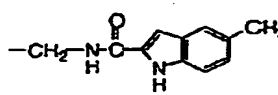
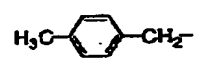
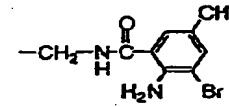
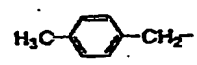
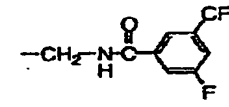
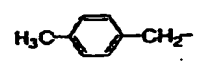
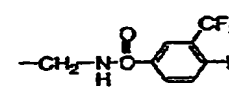
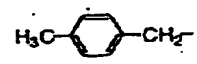
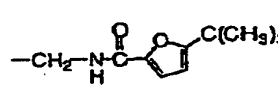
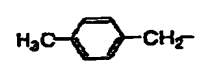
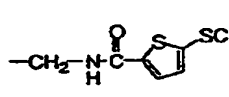
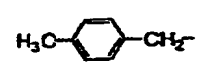
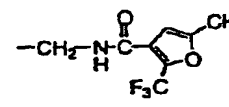
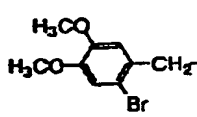
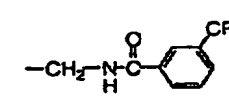
[0217]

Table 1.117

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1277		1	2	0	R	H	
1278		1	2	0	R	H	
1279		1	2	0	R	H	
1280		1	2	0	R	H	
1281		1	2	0	R	H	
1282		2	2	1	-	H	
1283		2	2	1	-	H	
1284		2	2	1	-	H	
1285		2	2	1	-	H	
1286		1	2	0	R	H	
1287		1	2	0	R	H	

[0218]

Table 1.118

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1288		1	2	0	R	H	
1289		1	2	0	R	H	
1290		1	2	0	R	H	
1291		1	2	0	R	H	
1292		1	2	0	R	H	
1293		1	2	0	R	H	
1294		1	2	0	R	H	
1295		1	2	0	R	H	
1296		1	2	0	R	H	
1297		1	2	0	R	H	
1298		1	2	0	R	H	

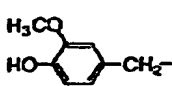
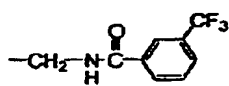
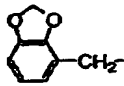
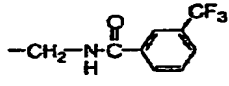
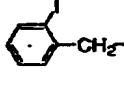
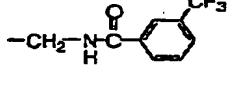
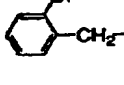
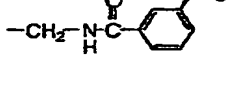
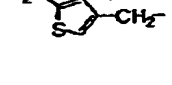
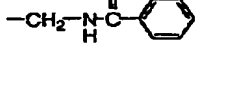
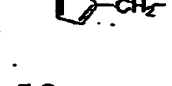
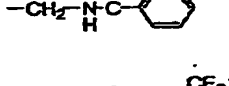
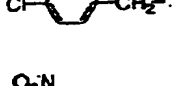
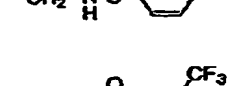
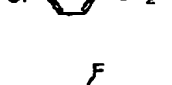
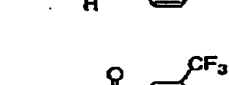


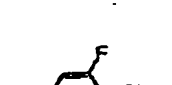



[0219]

Table 1.119

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1299		1	2	0	R	H	
1300		1	2	0	R	H	
1301		1	2	0	R	H	
1302		1	2	0	R	H	
1303		1	2	0	R	H	
1304		1	2	0	R	H	
1305		1	2	0	R	H	
1306		1	2	0	R	H	
1307		1	2	0	R	H	
1308		1	2	0	R	H	
1309		1	2	0	R	H	


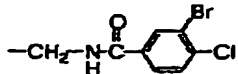
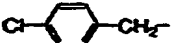
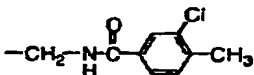
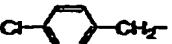
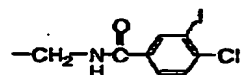

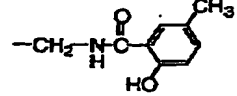

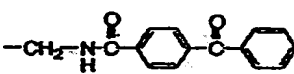

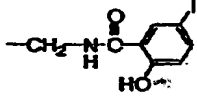
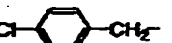
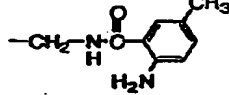

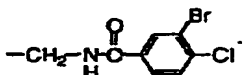

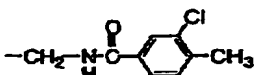

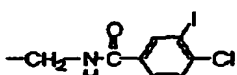

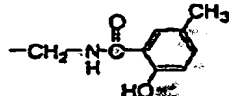
[0220]

Table 1.120

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
1310		1	2	0	R	H	
1311		1	2	0	R	H	
1312		1	2	0	R	H	
1313		1	2	0	R	H	
1314		1	2	0	R	H	
1315		1	2	0	R	H	
1316		1	2	0	R	H	
1317		1	2	0	R	H	
1318		1	2	0	R	H	
1319		1	2	0	R	H	
1320		1	2	0	R	H	

[0221]

Table 1.121

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_f \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
1321		1	2	0	R	H	
1322		1	2	0	R	H	
1323		1	2	0	R	H	
1324		1	2	0	R	H	
1325		1	2	0	R	H	
1326		1	2	0	R	H	
1327		1	2	0	R	H	
1328		1	2	0	R	H	
1329		1	2	0	R	H	
1330		1	2	0	R	H	
1331		1	2	0	R	H	

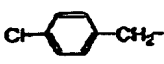
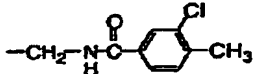
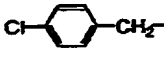
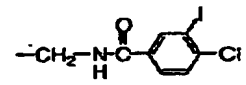
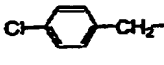
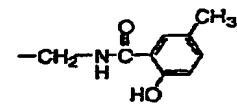
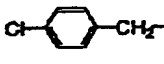
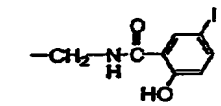
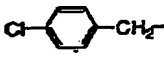
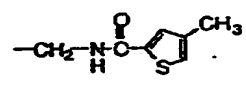
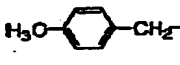
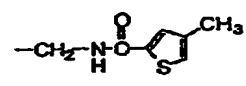
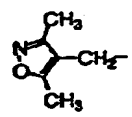
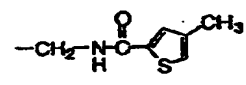
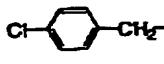
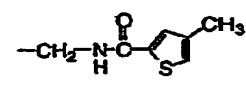
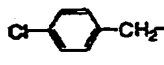
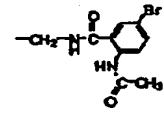
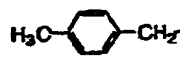
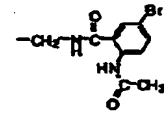
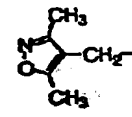
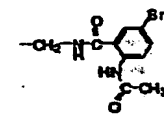
[0222]

Table 1.122

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1332		1	2	0	R	H	
1333		1	2	0	R	H	
1334		1	2	0	R	H	
1335		1	2	0	R	H	
1336		1	2	0	R	H	
1337		1	2	0	R	H	
1338		1	2	0	R	H	
1339		1	2	0	R	H	
1340		1	2	0	R	H	
1341		1	2	0	R	H	
1342		2	2	1	-	H	


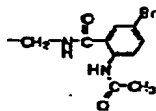
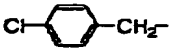
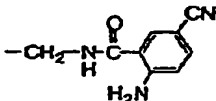

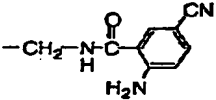
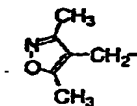
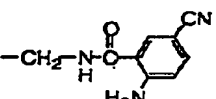
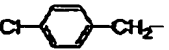
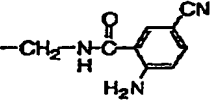
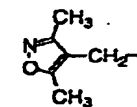
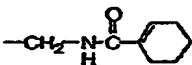
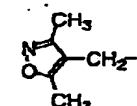
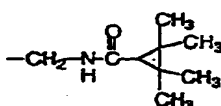

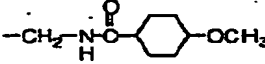
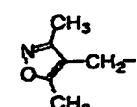
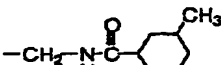
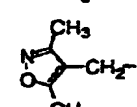
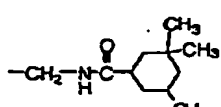
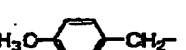
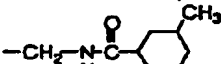
[0 2 2 3]

Table 1.123

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1343		2	2	1	-	H	
1344		2	2	1	-	H	
1345		2	2	1	-	H	
1346		2	2	1	-	H	
1347		1	2	0	R	H	
1348		1	2	0	R	H	
1349		1	2	0	R	H	
1350		2	2	1	-	H	
1351		1	2	0	R	H	
1352		1	2	0	R	H	
1353		1	2	0	R	H	

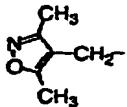
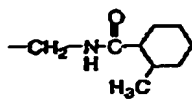
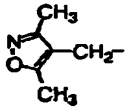
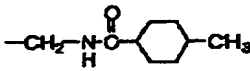

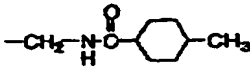

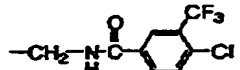

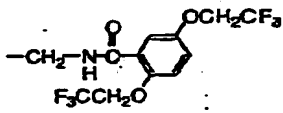

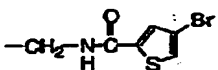
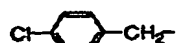
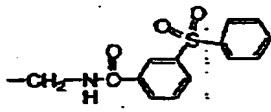

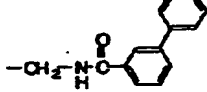

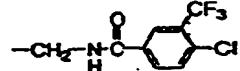

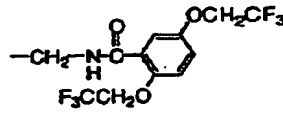

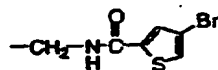
[0224]

Table 1.124

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1354		2	2	1	-	H	
1355		1	2	0	R	H	
1356		1	2	0	R	H	
1357		1	2	0	R	H	
1358		2	2	1	-	H	
1359		1	2	0	R	H	
1360		1	2	0	R	H	
1361		1	2	0	R	H	
1362		1	2	0	R	H	
1363		1	2	0	R	H	
1364		1	2	0	R	H	


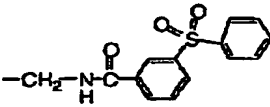

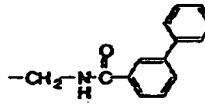
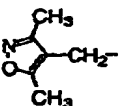
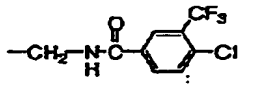
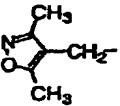
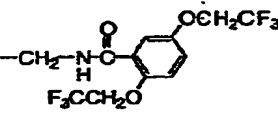
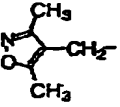
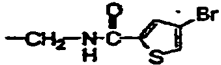
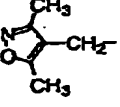
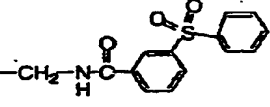
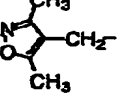
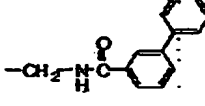
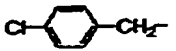
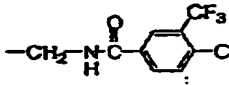

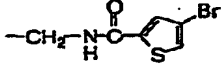

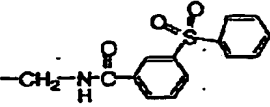
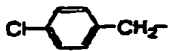
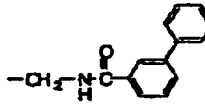
[0225]

Table 1.125

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1365		1	2	0	R	H	
1366		1	2	0	R	H	
1367		1	2	0	R	H	
1368		1	2	0	R	H	
1369		1	2	0	R	H	
1370		1	2	0	R	H	
1371		1	2	0	R	H	
1372		1	2	0	R	H	
1373		1	2	0	R	H	
1374		1	2	0	R	H	
1375		1	2	0	R	H	

[0226]

Tabl 1.126

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1376		1	2	0	R	H	
1377		1	2	0	R	H	
1378		1	2	0	R	H	
1379		1	2	0	R	H	
1380		1	2	0	R	H	
1381		1	2	0	R	H	
1382		1	2	0	R	H	
1383		2	2	1	-	H	
1384		2	2	1	-	H	
1385		2	2	1	-	H	
1386		2	2	1	-	H	

[0227]

Table 1.127

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1387		1	2	0	R	H	
1388		1	2	0	R	H	
1389		1	2	0	R	H	
1390		1	2	0	R	H	
1391		1	2	0	R	H	
1392		1	2	0	R	H	
1393		1	2	0	R	H	
1394		1	2	0	R	H	
1395		1	2	0	R	H	
1396		1	2	0	R	H	
1397		1	2	0	R	H	


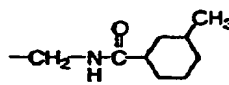
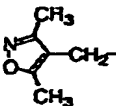
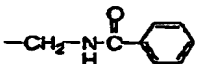
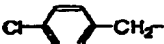
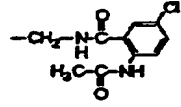

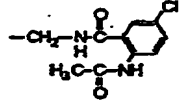
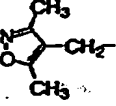
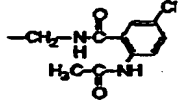

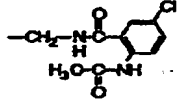
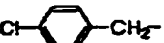
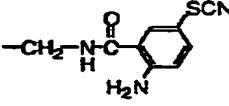

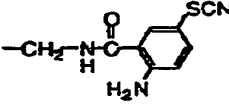
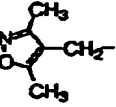
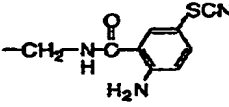

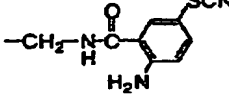

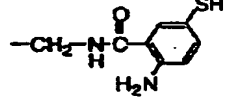
[0228]

Table 1.128

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
1398		1	2	0	R	H	
1399		1	2	0	R	H	
1400		1	2	0	R	H	
1401		1	2	0	R	H	
1402		1	2	0	R	H	
1403		1	2	0	R	H	
1404		1	2	0	R	H	
1405		1	2	0	R	H	
1406		1	2	0	R	H	
1407		1	2	0	R	H	
1408		1	2	0	R	H	

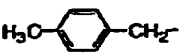
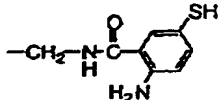
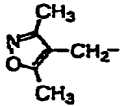
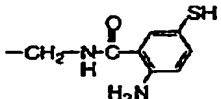
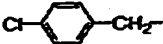
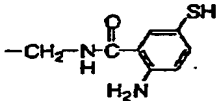
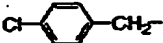
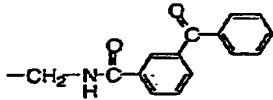

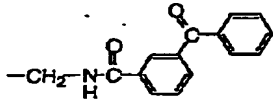
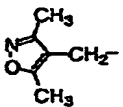
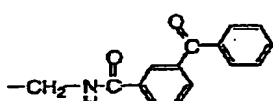
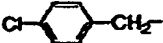
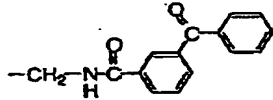
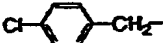
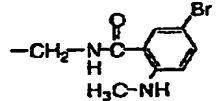
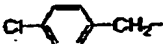
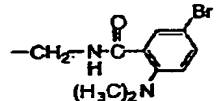
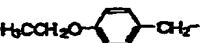
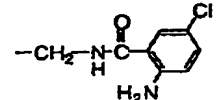
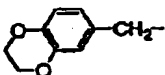
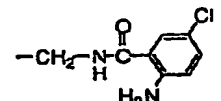
[0229]

Tabl 1.129

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1409		1	2	0	R	H	
1410		1	2	0	R	H	
1411		1	2	0	R	H	
1412		1	2	0	R	H	
1413		1	2	0	R	H	
1414		2	2	1	-	H	
1415		1	2	0	R	H	
1416		1	2	0	R	H	
1417		1	2	0	R	H	
1418		2	2	1	-	H	
1419		1	2	0	R	H	

【 0 2 3 0 】

Tabl 1.130

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1420		1	2	0	R	H	
1421		1	2	0	R	H	
1422		2	2	1	-	H	
1423		1	2	0	R	H	
1424		1	2	0	R	H	
1425		1	2	0	R	H	
1426		2	2	1	-	H	
1427		2	2	1	-	H	
1428		2	2	1	-	H	
1429		2	2	1	-	H	
1430		2	2	1	-	H	

[0231]

Tabl 1.131

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
1431	$\text{H}_3\text{COCH}_2\text{O---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$
1432	$\text{C}_6\text{H}_3(\text{OCH}_2)_2 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$
1433	$\text{H}_3\text{COCH}_2\text{O---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{NH}_2) \text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{OCH}_2\text{CH}_3$
1434	$\text{H}_3\text{COCH}_2\text{O---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{OCH}_2\text{CH}_3$
1435	$\text{H}_3\text{COCH}_2\text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{NH}_2) \text{---}$
1436	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{NH}_2) \text{---}$
1437	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})(\text{NH}_2) \text{---}$
1438	$\text{H}_3\text{COCH}_2\text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$
1439	$(\text{H}_3\text{C})_2\text{CH---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$
1440	$\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{O---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$
1441	$\text{H}_3\text{CS---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{CH}_2 \text{---}$	2	2	1	-	H	$\text{---} \text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{NH}_2) \text{---}$

[0232]

Table 1.132

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1442	$H_3COCH_2-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Cl)-NH-CH_2-C_6H_4-CH_2CH_3$
1443	$(H_3C)_2CH-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Cl)-NH-CH_2-C_6H_4-CH(OCH_3)_2$
1444	$H_3C(CH_2)_2O-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Cl)-NH-CH_2-C_6H_4-O(CH_2)_2CH_3$
1445	$H_3COCH_2-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br)-NH-CH_2-C_6H_4-CH_2CH_3$
1446	$(H_3C)_2CH-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br)-NH-CH_2-C_6H_4-CH(OCH_3)_2$
1447	$H_3C(CH_2)_2O-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br)-NH-CH_2-C_6H_4-O(CH_2)_2CH_3$
1448	$H_3CS-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br)-NH-CH_2-C_6H_4-SCH_3$
1449	$H_3COCH_2-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
1450	$(H_3C)_2CH-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
1451	$(H_3COCH_2)_2N-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$
1452	$H_3CO-C_6H_3(OH)-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_4-CF_3$


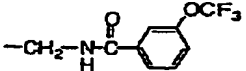

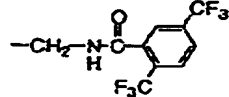

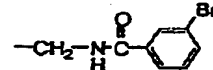
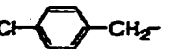
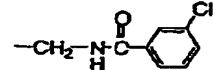
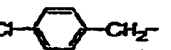
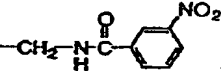
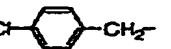
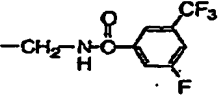
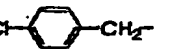
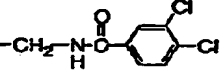
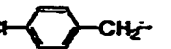
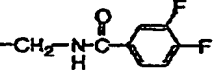
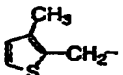
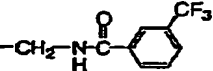
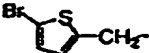
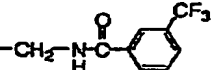
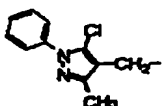
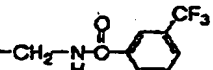
[0233]

Tabl 1.133

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1453		2	2	1	-	H	
1454		2	2	1	-	H	
1455		2	2	1	-	H	
1456		2	2	1	-	H	
1457		2	2	1	-	H	
1458		2	2	1	-	H	
1459		2	2	1	-	H	
1460		2	2	1	-	H	
1461		2	2	1	-	H	
1462		2	2	1	-	H	
1463		2	1	1	-	H	

[0234]

Table 1.134

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1464		2	1	1	-	H	
1465		2	1	1	-	H	
1466		2	1	1	-	H	
1467		2	1	1	-	H	
1468		2	1	1	-	H	
1469		2	1	1	-	H	
1470		2	1	1	-	H	
1471		2	1	1	-	H	
1472		1	2	0	R	H	
1473		1	2	0	R	H	
1474		1	2	0	R	H	

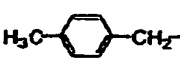
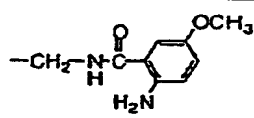
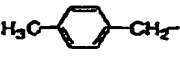
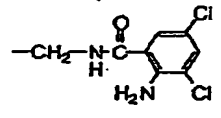
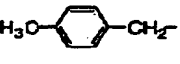
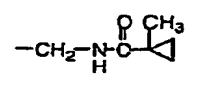
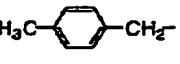
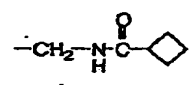
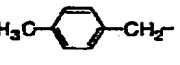
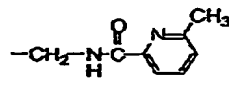
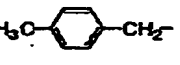
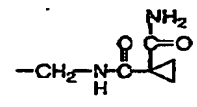
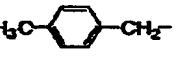
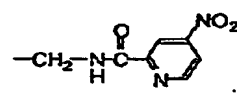
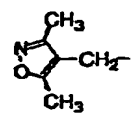
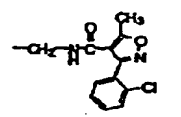
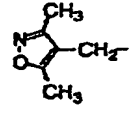
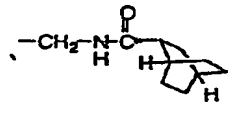
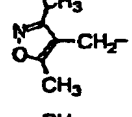
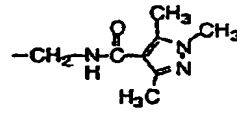
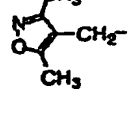
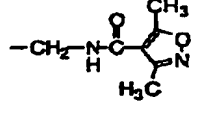
[0235]

Tabl 1.135

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1475		1	2	0	R	H	
1476		1	2	0	R	H	
1477		1	2	0	R	H	
1478		1	2	0	R	H	
1479		1	2	0	R	H	
1480		1	2	0	R	H	
1481		1	2	0	R	H	
1482		1	2	0	R	H	
1483		1	2	0	R	H	
1484		1	2	0	R	H	
1485		1	2	0	R	H	

[0236]

Tabl 1.136

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1486		1	2	0	R	H	
1487		1	2	0	R	H	
1488		1	2	0	R	H	
1489		1	2	0	R	H	
1490		1	2	0	R	H	
1491		1	2	0	R	H	
1492		1	2	0	R	H	
1493		1	2	0	R	H	
1494		1	2	0	R	H	
1495		1	2	0	R	H	
1496		1	2	0	R	H	

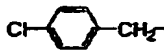
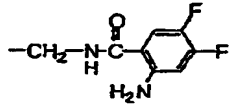
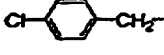
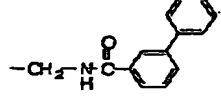
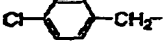
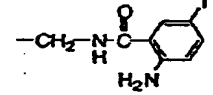
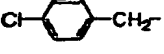
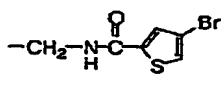
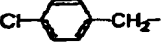
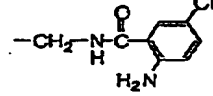

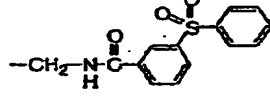
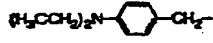
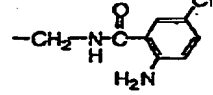
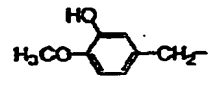
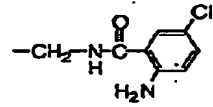
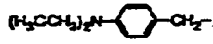
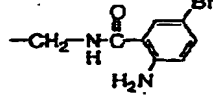
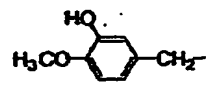
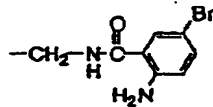
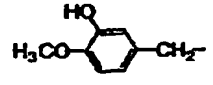
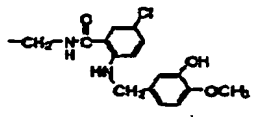
[0237]

Table 1.137

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
1497		1	2	0	R	H	
1498		1	2	0	R	H	
1499		1	2	0	R	H	
1500		1	2	0	R	H	
1501		1	2	0	R	H	
1502		1	2	0	R	H	
1503		1	2	0	R	H	
1504		1	2	0	R	H	
1505		1	2	0	R	H	
1506		2	1	1	-	H	
1507		2	1	1	-	H	

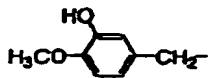
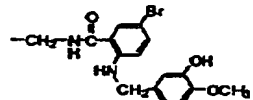
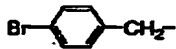
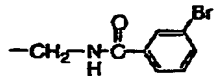

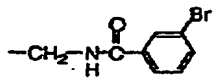
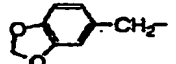
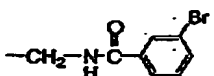
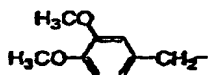
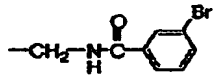
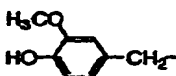
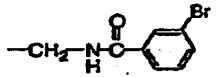

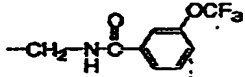

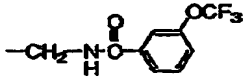
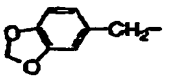
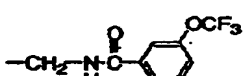
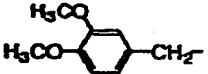
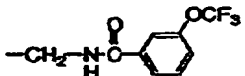
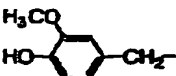
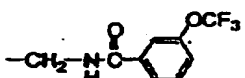
[0238]

Table 1.138

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1508		2	1	1	-	H	
1509		2	1	1	-	H	
1510		2	1	1	-	H	
1511		2	1	1	-	H	
1512		2	1	1	-	H	
1513		2	1	1	-	H	
1514		2	2	1	-	H	
1515		2	2	1	-	H	
1516		2	2	1	-	H	
1517		2	2	1	-	H	
1518		2	2	1	-	H	


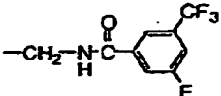

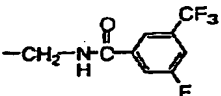
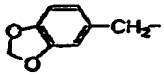
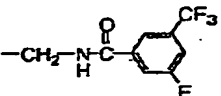

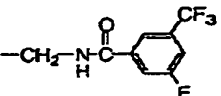
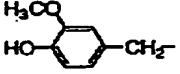
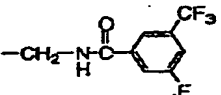

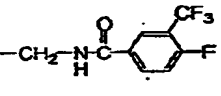

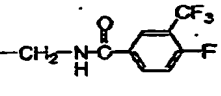
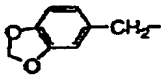
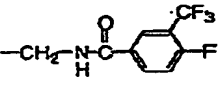
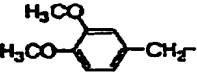
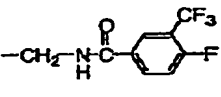
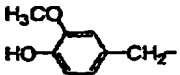
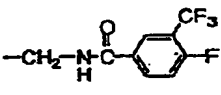

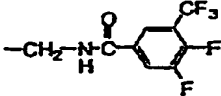
【0239】

Table 1.139

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1519		2	2	1	-	H	
1520		1	2	0	R	H	
1521		1	2	0	R	H	
1522		1	2	0	R	H	
1523		1	2	0	R	H	
1524		1	2	0	R	H	
1525		1	2	0	R	H	
1526		1	2	0	R	H	
1527		1	2	0	R	H	
1528		1	2	0	R	H	
1529		1	2	0	R	H	


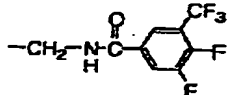
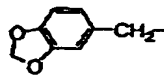
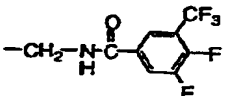
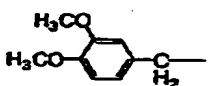
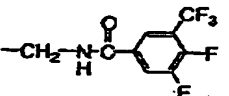
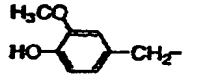
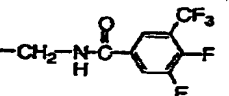
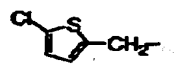
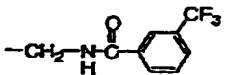
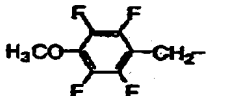
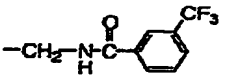
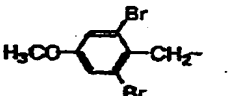
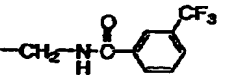
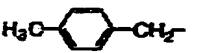
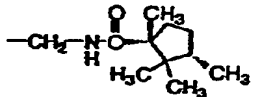
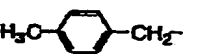
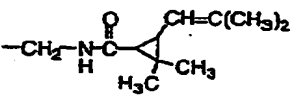
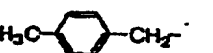
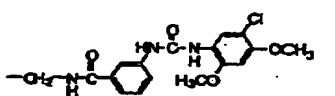
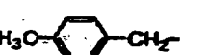
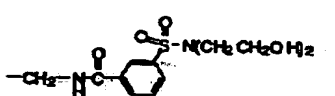
[0240]

Table 1.140

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
1530		1	2	0	R	H	
1531		1	2	0	R	H	
1532		1	2	0	R	H	
1533		1	2	0	R	H	
1534		1	2	0	R	H	
1535		1	2	0	R	H	
1536		1	2	0	R	H	
1537		1	2	0	R	H	
1538		1	2	0	R	H	
1539		1	2	0	R	H	
1540		1	2	0	R	H	


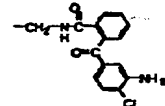

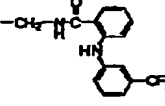
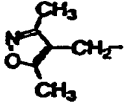
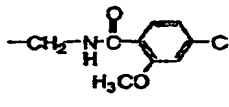
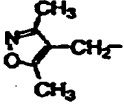
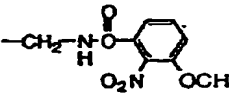
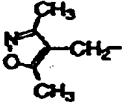
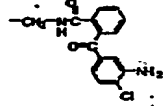
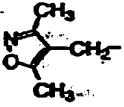
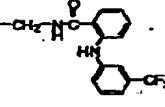
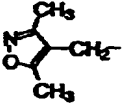
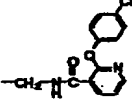

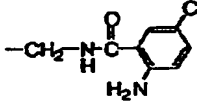

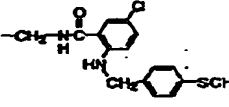

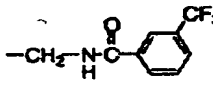
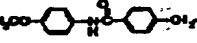
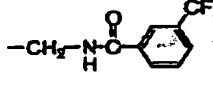
[0241]

Table 1.141

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - R^6$
1541		1	2	0	R	H	
1542		1	2	0	R	H	
1543		1	2	0	R	H	
1544		1	2	0	R	H	
1545		1	2	0	R	H	
1546		1	2	0	R	H	
1547		1	2	0	R	H	
1548		1	2	0	R	H	
1549		1	2	0	R	H	
1550		1	2	0	R	H	
1551		1	2	0	R	H	

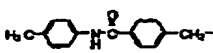
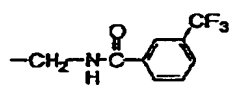
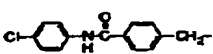
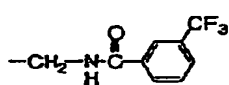
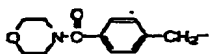
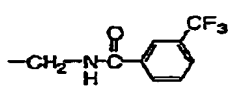
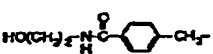
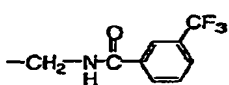
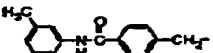
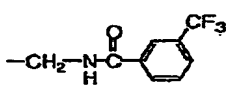
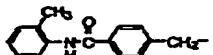
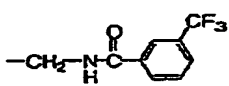
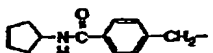
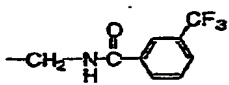

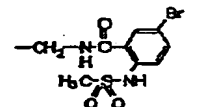
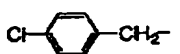
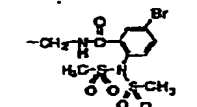
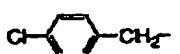
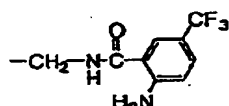
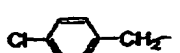
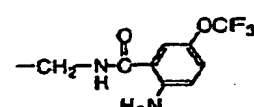
[0 2 4 3]

Table 1.143

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1563		1	2	0	R	H	
1564		1	2	0	R	H	
1565		1	2	0	R	H	
1566		1	2	0	R	H	
1567		1	2	0	R	H	
1568		1	2	0	R	H	
1569		1	2	0	R	H	
1570		2	2	1	-	H	
1571		2	2	1	-	H	
1572		2	2	1	-	H	
1573		2	2	1	-	H	


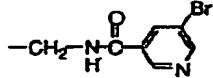

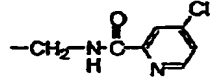

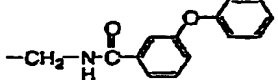

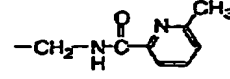

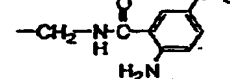

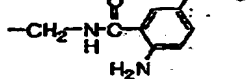

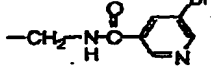

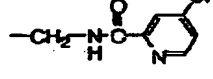

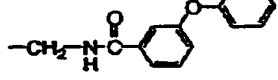
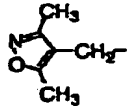
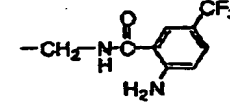
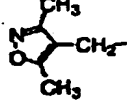
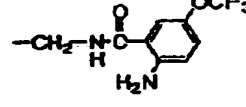
[0244]

Table 1.144

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1574		2	2	1	-	H	
1575		2	2	1	-	H	
1576		2	2	1	-	H	
1577		2	2	1	-	H	
1578		2	2	1	-	H	
1579		2	2	1	-	H	
1580		2	2	1	-	H	
1581		2	2	1	-	H	
1582		2	2	1	-	H	
1583		1	2	0	R	H	
1584		1	2	0	R	H	

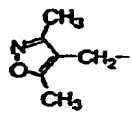
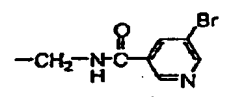
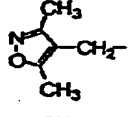
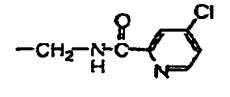
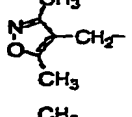
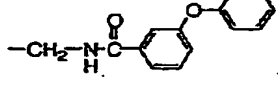
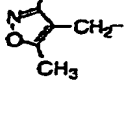
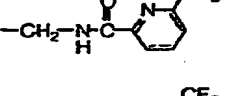
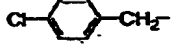
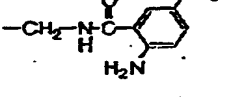
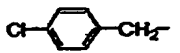
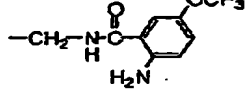

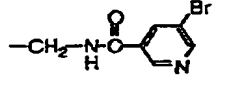

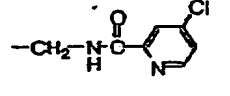
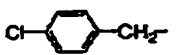
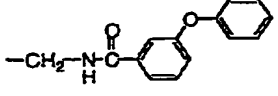

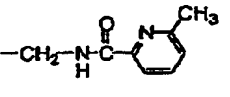
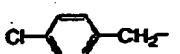
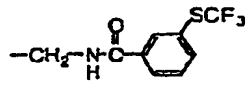
[0245]

Tabl 1.145

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_f \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q - R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
1585		1	2	0	R	H	
1586		1	2	0	R	H	
1587		1	2	0	R	H	
1588		1	2	0	R	H	
1589		1	2	0	R	H	
1590		1	2	0	R	H	
1591		1	2	0	R	H	
1592		1	2	0	R	H	
1593		1	2	0	R	H	
1594		1	2	0	R	H	
1595		1	2	0	R	H	


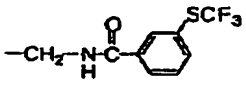
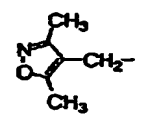
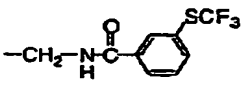

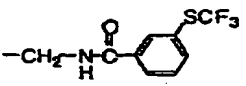
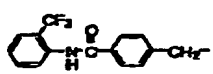
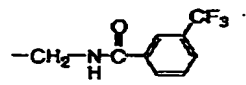
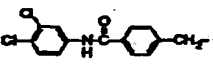
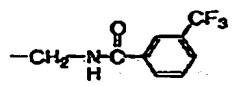
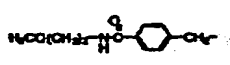
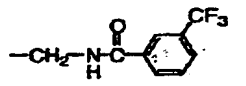
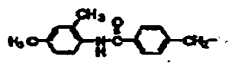
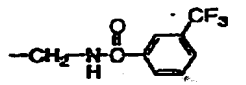
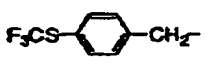
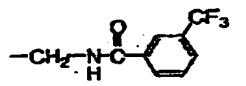
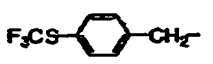
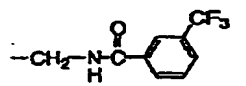
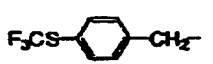
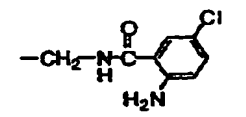
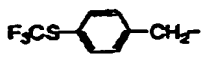
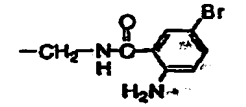
[0 2 4 6]

Table 1.146

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1596		1	2	0	R	H	
1597		1	2	0	R	H	
1598		1	2	0	R	H	
1599		1	2	0	R	H	
1600		2	2	1	-	H	
1601		2	2	1	-	H	
1602		2	2	1	-	H	
1603		2	2	1	-	H	
1604		2	2	1	-	H	
1605		2	2	1	-	H	
1606		1	2	0	R	H	

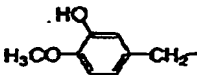
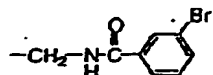
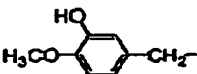
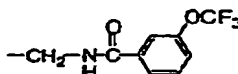
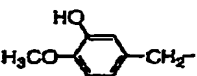
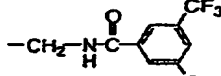
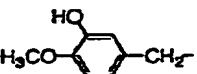
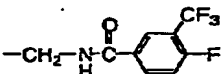
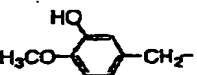
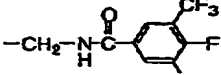
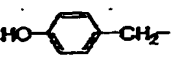
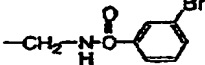
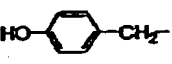
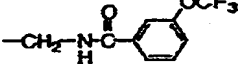
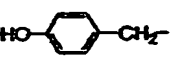
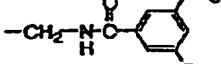
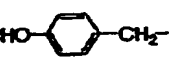
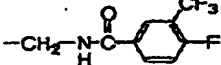
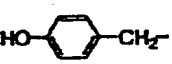
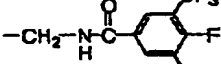
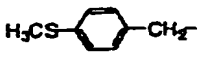
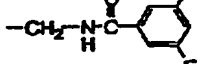
[0247]

Tabl 1.147

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1607		1	2	0	R	H	
1608		1	2	0	R	H	
1609		2	2	1	-	H	
1610		2	2	1	-	H	
1611		2	2	1	-	H	
1612		2	2	1	-	H	
1613		2	2	1	-	H	
1614		1	2	0	R	H	
1615		2	2	1	-	H	
1616		2	2	1	-	H	
1617		2	2	1	-	H	

[0248]

Table 1.148

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1618		1	2	0	R	H	
1619		1	2	0	R	H	
1620		1	2	0	R	H	
1621		1	2	0	R	H	
1622		1	2	0	R	H	
1623		1	2	0	R	H	
1624		1	2	0	R	H	
1625		1	2	0	R	H	
1626		1	2	0	R	H	
1627		1	2	0	R	H	
1628		1	2	0	R	H	

[0249]

Table 1.149

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1629		1	2	0	R	H	
1630		1	2	0	R	H	
1631		1	2	0	R	H	
1632		1	2	0	R	H	
1633		1	2	0	R	H	
1634		1	2	0	R	H	
1635		1	2	0	R	H	
1636		1	2	0	R	H	
1637		1	2	0	R	H	
1638		1	2	0	R	H	
1639		1	2	0	R	H	

[0 2 5 0]

Table 1.150

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1640		1	2	0	R	H	
1641		1	2	0	R	H	
1642		1	2	0	R	H	
1643		1	2	0	R	H	
1644		1	2	0	R	H	
1645		1	2	0	R	H	
1646		1	2	0	R	H	
1647		2	2	1	-	H	
1648		1	2	0	R	H	
1649		2	2	1	-	H	
1650		1	2	0	R	H	


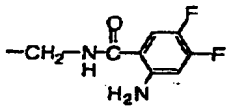
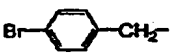
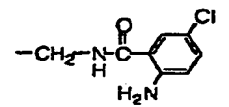

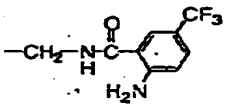

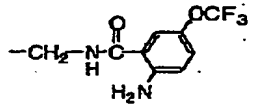
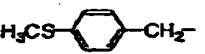
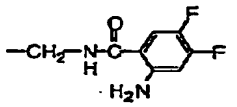
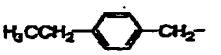
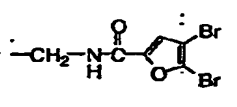
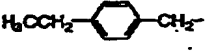
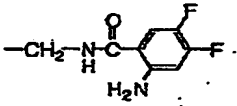
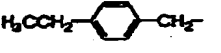
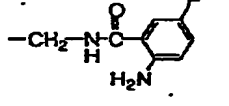
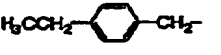
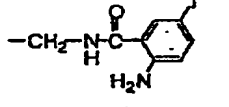
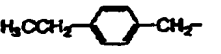
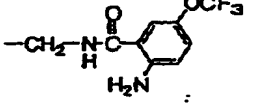
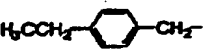
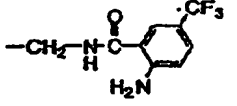
[0251]

Table 1.151

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1651	$H_3C(CH_2)_3 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1652	$H_3C(CH_2)_3 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1653	$H_3C(CH_2)_2 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1654	$H_3C(CH_2)_3 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1655	$H_3C(CH_2)_3 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1656	$H_3C(CH_2)_3 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1657	$H_3C(CH_2)_2 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1658	$H_3C(CH_2)_2 - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1659	$Cl - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	2	2	1	-	H	
1660	$Br - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	1	2	0	R	H	
1661	$Br - \text{C}_6\text{H}_4 - CH_2 -$	1	2	0	R	H	

[0252]

Tabl 1.152

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - R^6$
1662		1	2	0	R	H	
1663		1	2	0	R	H	
1664		2	2	1	-	H	
1665		2	2	1	-	H	
1666		2	2	1	-	H	
1667		2	2	1	-	H	
1668		2	2	1	-	H	
1669		2	2	1	-	H	
1670		2	2	1	-	H	
1671		2	2	1	-	H	
1672		2	2	1	-	H	

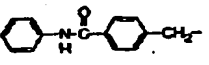
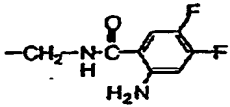
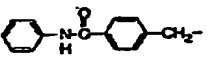
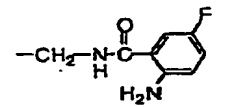
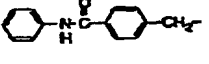
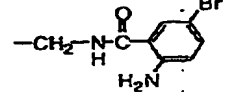
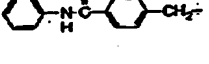
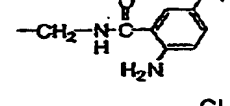

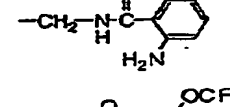
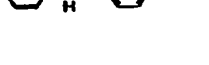
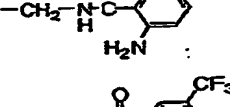

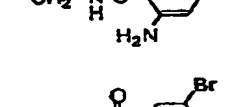
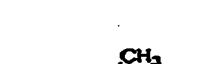
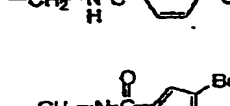
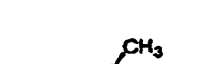
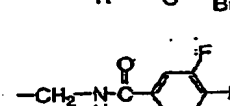
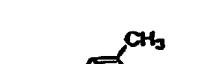
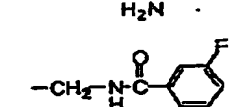
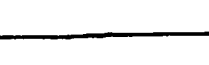

[0 2 5 3]

Table 1.153

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_f$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1673	$H_3CCH_2-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br, Cl)-$
1674	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_5H_2(Br)_2O-$
1675	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)_2(NH_2)-$
1676	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(F)(NH_2)-$
1677	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br)(NH_2)-$
1678	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(I)(NH_2)-$
1679	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Cl)(NH_2)-$
1680	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(OCF_3)(NH_2)-$
1681	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(CF_3)(NH_2)-$
1682	$F-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_6H_3(Br, Cl)-$
1683	$C_6H_5-NH-C(=O)-C_6H_4-CH_2-$	2	2	1	-	H	$-CH_2-NH-C(=O)-C_5H_2(Br)_2O-$

[0254]

Table 1.154

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ (CH_2)_q - R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
1684		2	2	1	-	H	
1685		2	2	1	-	H	
1686		2	2	1	-	H	
1687		2	2	1	-	H	
1688		2	2	1	-	H	
1689		2	2	1	-	H	
1690		2	2	1	-	H	
1691		2	2	1	-	H	
1692		1	2	0	R	H	
1693		1	2	0	R	H	
1694		1	2	0	R	H	

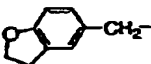
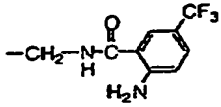

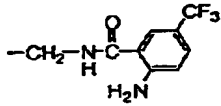
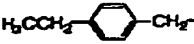
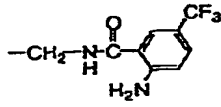
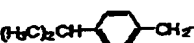
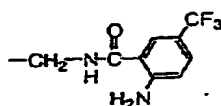
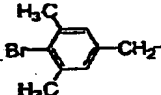
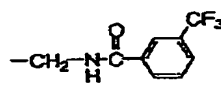
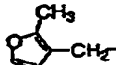
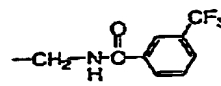
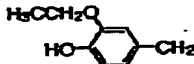
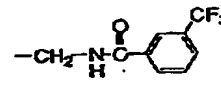
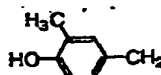
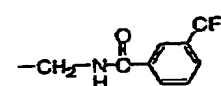
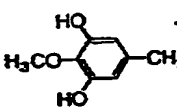
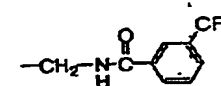
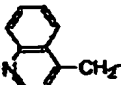
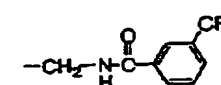

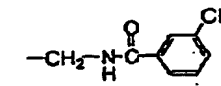
[0255]

Table 1.155

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q G-R^6$
1695		1	2	0	R	H	
1696		1	2	0	R	H	
1697		1	2	0	R	H	
1698		1	2	0	R	H	
1699		1	2	0	R	H	
1700		1	2	0	R	H	
1701		1	2	0	R	H	
1702		1	2	0	R	H	
1703		1	2	0	R	H	
1704		1	2	0	R	H	
1705		1	2	0	R	H	

[0256]

Table 1.156

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1706		1	2	0	R	H	
1707		1	2	0	R	H	
1708		1	2	0	R	H	
1709		1	2	0	R	H	
1710		1	2	0	R	H	
1711		1	2	0	R	H	
1712		1	2	0	R	H	
1713		1	2	0	R	H	
1714		1	2	0	R	H	
1715		1	2	0	R	H	
1716		1	2	0	R	H	

[0 2 5 7]

Tabl 1.157

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1717		1	2	0	R	H	
1718		1	2	0	R	H	
1719		1	2	0	R	H	
1720		1	2	0	R	H	
1721		1	2	0	R	H	
1722		1	2	0	R	H	
1723		1	2	0	R	H	
1724		1	2	0	R	H	
1725		1	2	0	R	H	
1726		1	2	0	R	H	
1727		1	2	0	R	H	

[0258]

Table 1.158

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
1728		1	2	0	R	H	
1729		1	2	0	R	H	
1730		1	2	0	R	H	
1731		1	2	0	R	H	
1732		1	2	0	R	H	
1733		1	2	0	R	H	
1734		1	2	0	R	H	
1735		1	2	0	R	H	
1736		1	2	0	R	H	
1737		1	2	0	R	H	
1738		1	2	0	R	H	

[0259]

Table 1.159

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1739	$(H_3C)_2CH \text{---} \text{C}_6H_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_3(\text{F})_2\text{CF}_3$
1740	$\text{C}_{10}H_7 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1741	$H_3CS \text{---} \text{C}_6H_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1742	$H_3CCH_2 \text{---} \text{C}_6H_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1743	$\text{C}_{10}H_7 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1744	$H_3CO \text{---} \text{C}_6H_3(\text{CH}_3) \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1745	$H_3CO \text{---} \text{C}_6H_3(\text{CH}_3)_2 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1746	$(H_3C)_2CH \text{---} \text{C}_6H_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_4\text{Br}$
1747	$\text{C}_{10}H_7 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_3(\text{NH}_2)\text{Br}$
1748	$H_3CCH_2 \text{---} \text{C}_6H_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_3(\text{NH}_2)\text{Br}$
1749	$H_3CO \text{---} \text{C}_6H_3(\text{CH}_3) \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$-\text{CH}_2 \text{---} \text{NH} \text{---} \text{C}(=\text{O}) \text{---} \text{C}_6H_3(\text{NH}_2)\text{Br}$


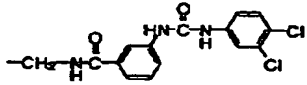
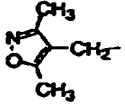
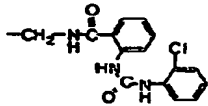
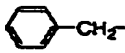
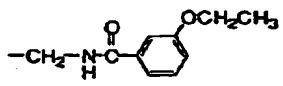
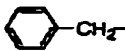
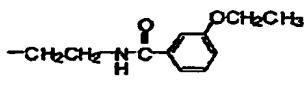
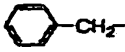
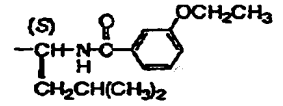
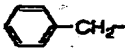
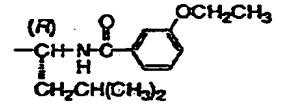
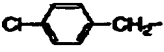
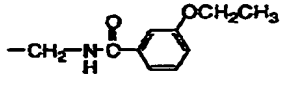
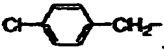
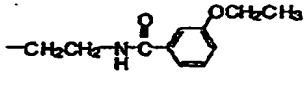
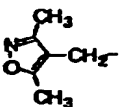
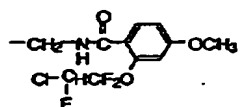
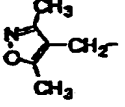
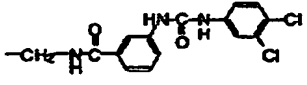
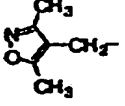
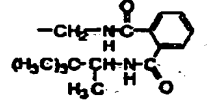
[0260]

Tabl 1.160

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1750		1	2	0	R	H	
1751		1	2	0	R	H	
1752		1	2	0	R	H	
1753		1	2	0	R	H	
1754		1	2	0	R	H	
1755		1	2	0	R	H	
1756		1	2	0	R	H	
1757		1	2	0	R	H	
1758		1	2	0	R	H	
1759		1	2	0	R	H	
1760		1	2	0	R	H	

[0261]

Table 1.161

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1761		1	2	0	R	H	
1762		1	2	0	R	H	
1763		2	2	0	-	H	
1764		2	2	0	-	H	
1765		2	2	0	-	H	
1766		2	2	0	-	H	
1767		1	3	1	-	H	
1768		1	3	1	-	H	
1769		1	2	0	R	H	
1770		1	2	0	R	H	
1771		1	2	0	R	H	

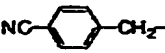
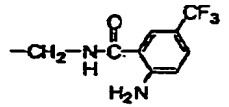
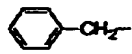
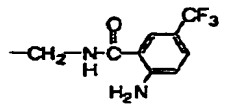
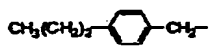
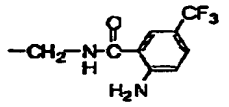
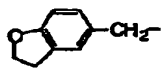
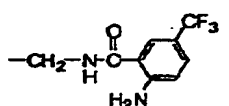
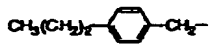
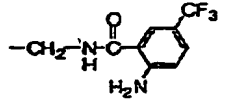
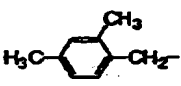
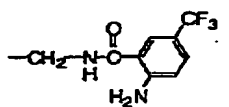

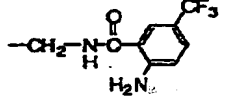

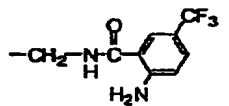
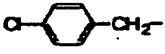
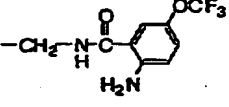
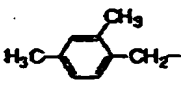
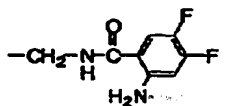
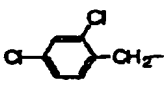
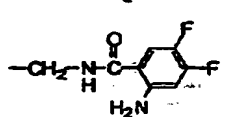
[0262]

Tabl 1.162

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_l \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1772		1	2	0	R	H	
1773		1	2	0	R	H	
1774		1	2	0	R	H	
1775		1	2	0	R	H	
1776		1	2	0	R	H	
1777		2	2	1	-	H	
1778		2	2	1	-	H	
1779		2	2	1	-	H	
1780		2	2	1	-	H	
1781		2	2	1	-	H	
1782		2	2	1	-	H	


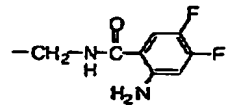
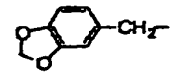
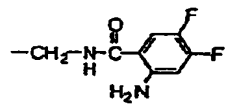
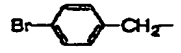
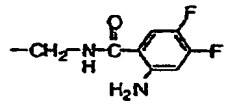
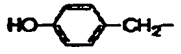
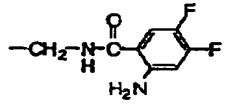

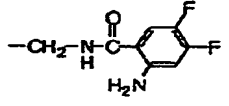
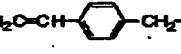
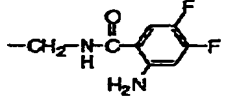
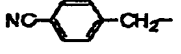
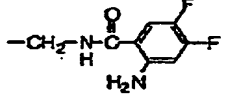
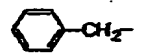
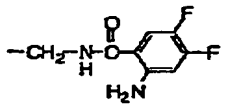
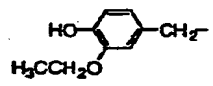
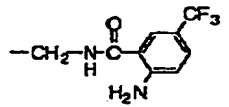
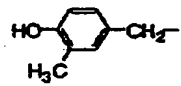
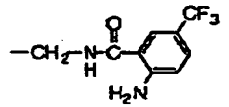
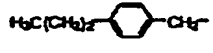
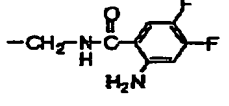
[0263]

Table 1.163

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_l - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1783		2	2	1	-	H	
1784		2	2	1	-	H	
1785		2	2	1	-	H	
1786		2	2	1	-	H	
1787		1	2	0	R	H	
1788		2	2	1	-	H	
1789		2	2	1	-	H	
1790		1	2	0	S	H	
1791		1	2	0	S	H	
1792		2	2	1	-	H	
1793		2	2	1	-	H	


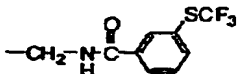

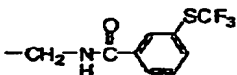
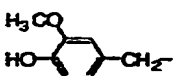
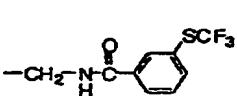
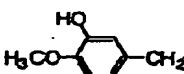
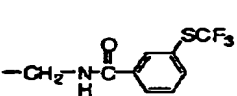

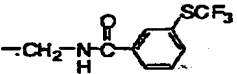
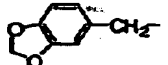
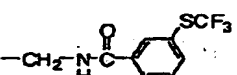
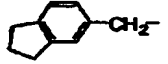
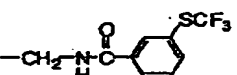

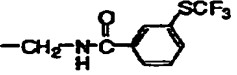
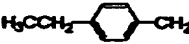
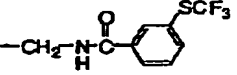
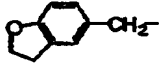
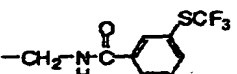
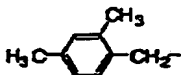
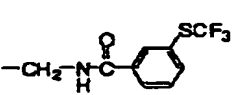
[0264]

Table 1.164

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1794		2	2	1	-	H	
1795		2	2	1	-	H	
1796		2	2	1	-	H	
1797		2	2	1	-	H	
1798		2	2	1	-	H	
1799		2	2	1	-	H	
1800		2	2	1	-	H	
1801		2	2	1	-	H	
1802		1	2	0	R	H	
1803		1	2	0	R	H	
1804		2	2	1	-	H	

【0265】

Tabl 1.165

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1805		1	2	0	R	H	
1806		1	2	0	R	H	
1807		1	2	0	R	H	
1808		1	2	0	R	H	
1809		1	2	0	R	H	
1810		1	2	0	R	H	
1811		1	2	0	R	H	
1812		1	2	0	R	H	
1813		1	2	0	R	H	
1814		1	2	0	R	H	
1815		1	2	0	R	H	

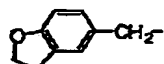
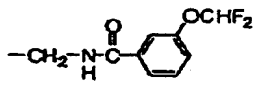
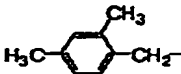
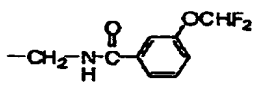
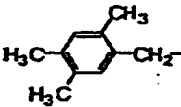
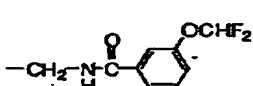
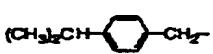
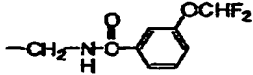

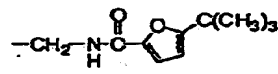

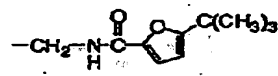
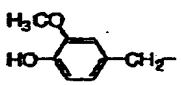
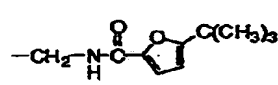
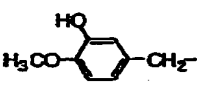
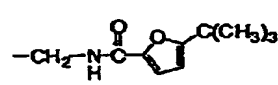

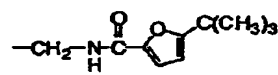
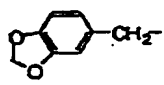
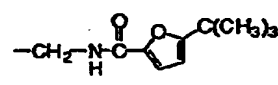
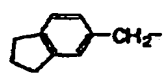
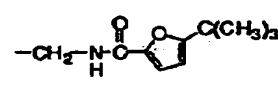
[0266]

Table 1.166

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (CH_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (CH_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1816	$(CH_3)_2CH \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} SCF_3$
1817	$(CH_3)_3C \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} SCF_3$
1818	$Br \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1819	$H_3CO \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1820	$H_3CO \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(OH) \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1821	$HO \text{---} \text{C}_6\text{H}_3(H_3CO) \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1822	$HO \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1823	$\text{C}_6\text{H}_3(O)_2 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1824	$\text{C}_6\text{H}_3 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1825	$H_3CS \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$
1826	$H_3COCH_2 \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} CH_2 \text{---}$	1	2	0	R	H	$\text{---} CH_2 \text{---} N \text{---} C(=O) \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} OCHF_2$

[0267]

Tabl 1.167

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1827		1	2	0	R	H	
1828		1	2	0	R	H	
1829		1	2	0	R	H	
1830		1	2	0	R	H	
1831		1	2	0	R	H	
1832		1	2	0	R	H	
1833		1	2	0	R	H	
1834		1	2	0	R	H	
1835		1	2	0	R	H	
1836		1	2	0	R	H	
1837		1	2	0	R	H	

[0268]

Table 1.168

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1838		1	2	0	R	H	
1839		1	2	0	R	H	
1840		1	2	0	R	H	
1841		1	2	0	R	H	
1842		1	2	0	R	H	
1843		1	2	0	R	H	
1844		1	2	0	R	H	
1845		1	2	0	R	H	
1846		1	2	0	R	H	
1847		1	2	0	R	H	
1848		1	2	0	R	H	

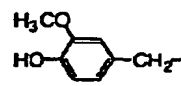
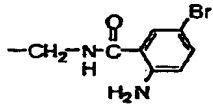
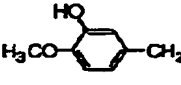
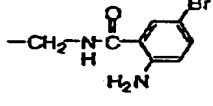
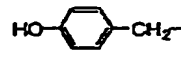
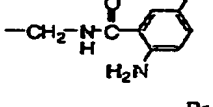
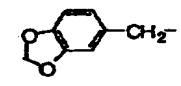
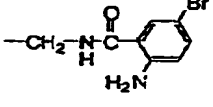
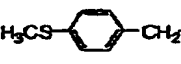
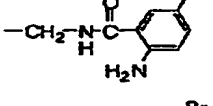
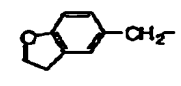
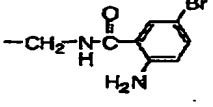
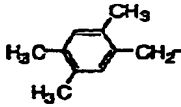
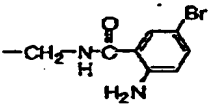
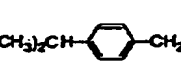
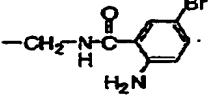
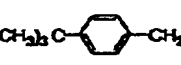
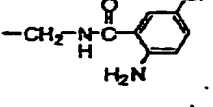
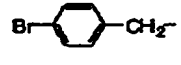
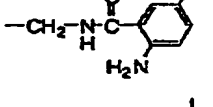
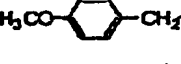
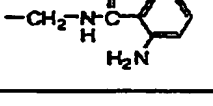
[0 2 6 9]

Tabl 1.169

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G} \text{---} R^6$
1849		1	2	0	R	H	
1850		1	2	0	R	H	
1851		1	2	0	R	H	
1852		1	2	0	R	H	
1853		1	2	0	R	H	
1854		1	2	0	R	H	
1855		1	2	0	R	H	
1856		1	2	0	R	H	
1857		1	2	0	R	H	
1858		1	2	0	R	H	
1859		1	2	0	R	H	

[0270]

Table 1.170

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5-CH-CH_2- \end{matrix}-(CH_2)_q-G-R^6$
1860		1	2	0	R	H	
1861		1	2	0	R	H	
1862		1	2	0	R	H	
1863		1	2	0	R	H	
1864		1	2	0	R	H	
1865		1	2	0	R	H	
1866		1	2	0	R	H	
1867		1	2	0	R	H	
1868		1	2	0	R	H	
1869		1	2	0	R	H	
1870		1	2	0	R	H	

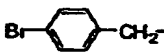
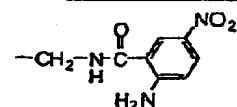
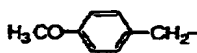
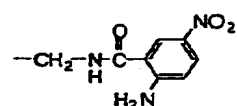
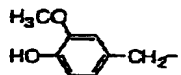
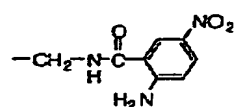
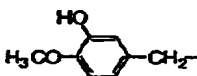
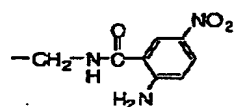
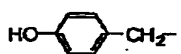
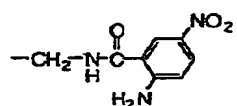
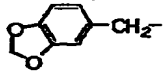
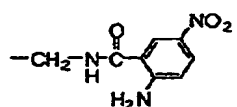
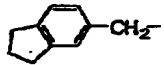
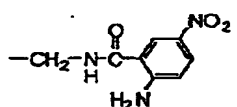

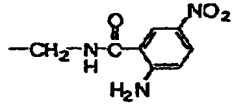
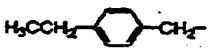
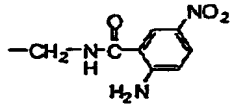
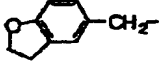
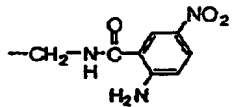
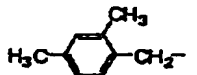
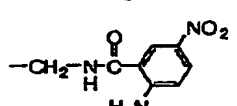
【0271】

Table 1.171

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1871		1	2	0	R	H	
1872		1	2	0	R	H	
1873		1	2	0	R	H	
1874		1	2	0	R	H	
1875		1	2	0	R	H	
1876		1	2	0	R	H	
1877		1	2	0	R	H	
1878		1	2	0	R	H	
1879		1	2	0	R	H	
1880		1	2	0	R	H	
1881		1	2	0	R	H	

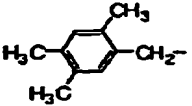
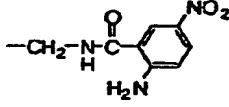
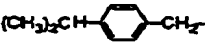
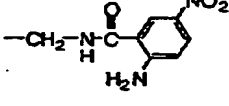
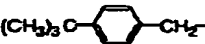
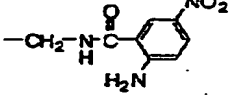
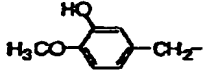
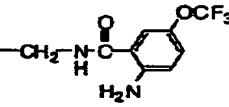

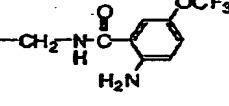
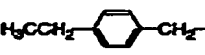
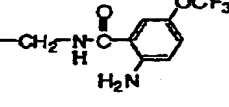
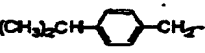
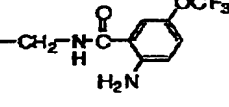
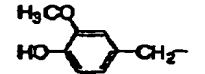
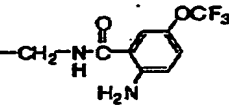
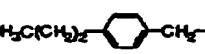
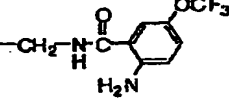
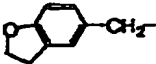
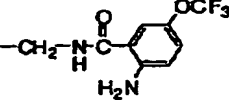
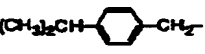
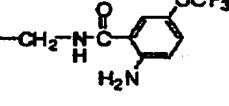
[0 2 7 2]

Table 1.172

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1882		1	2	0	R	H	
1883		1	2	0	R	H	
1884		1	2	0	R	H	
1885		1	2	0	R	H	
1886		1	2	0	R	H	
1887		1	2	0	R	H	
1888		1	2	0	R	H	
1889		1	2	0	R	H	
1890		1	2	0	R	H	
1891		1	2	0	R	H	
1892		1	2	0	R	H	

[0273]

Table 1.173

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2-CH-CH_2- \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
1893		1	2	0	R	H	
1894		1	2	0	R	H	
1895		1	2	0	R	H	
1896		1	2	0	R	H	
1897		1	2	0	R	H	
1898		1	2	0	R	H	
1899		1	2	0	R	H	
1900		1	2	0	R	H	
1901		1	2	0	R	H	
1902		1	2	0	R	H	
1903		2	2	1	-	H	

[0274]

Table 1.174

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1904		2	2	1	-	H	
1905		1	2	0	R	H	
1906		1	2	0	R	H	
1907		1	2	0	R	H	
1908		1	2	0	R	H	
1909		1	2	0	R	H	
1910		2	2	1	-	H	
1911		2	2	1	-	H	
1912		2	2	1	-	H	
1913		2	2	1	-	H	
1914		2	2	1	-	H	

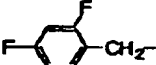
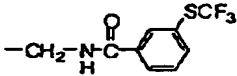

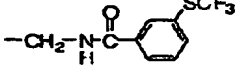
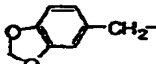
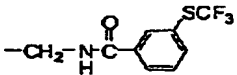
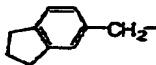
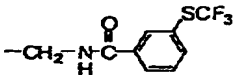

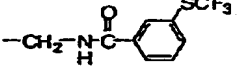
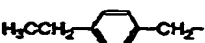
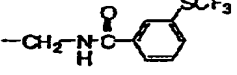
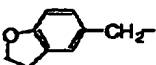
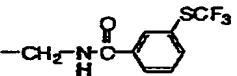
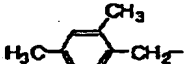
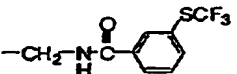
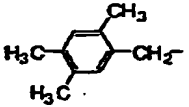
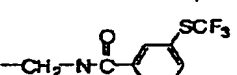

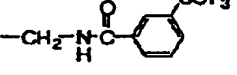

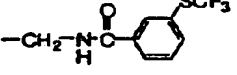
[0275]

Table 1.175

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1915		1	2	0	R	H	
1916		1	2	0	R	H	
1917		2	2	1	-	H	
1918		2	2	1	-	H	
1919		2	2	1	-	H	
1920		2	2	1	-	H	
1921		1	2	0	R	H	
1922		2	2	1	-	H	
1923		2	2	1	-	H	
1924		2	2	1	-	H	
1925		2	2	1	-	H	

[0 2 7 6]

Table 1.176

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1926		2	2	1	-	H	
1927		2	2	1	-	H	
1928		2	2	1	-	H	
1929		2	2	1	-	H	
1930		2	2	1	-	H	
1931		2	2	1	-	H	
1932		2	2	1	-	H	
1933		2	2	1	-	H	
1934		2	2	1	-	H	
1935		2	2	1	-	H	
1936		2	2	1	-	H	

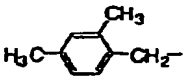
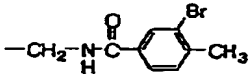
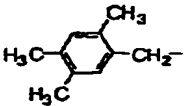
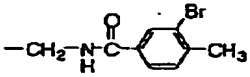

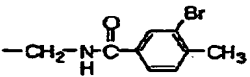
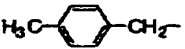
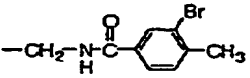
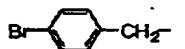
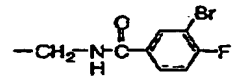

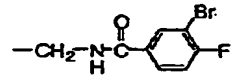
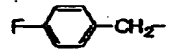
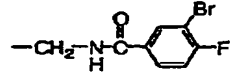
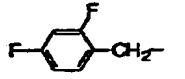
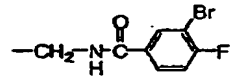
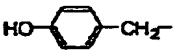
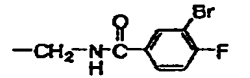
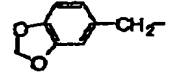
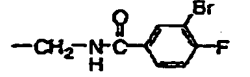
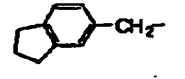
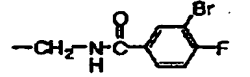
【0277】

Table 1.177

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1937		2	2	1	-	H	
1938		2	2	1	-	H	
1939		2	2	1	-	H	
1940		2	2	1	-	H	
1941		2	2	1	-	H	
1942		2	2	1	-	H	
1943		2	2	1	-	H	
1944		2	2	1	-	H	
1945		2	2	1	-	H	
1946		2	2	1	-	H	
1947		2	2	1	-	H	


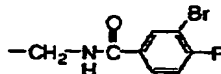
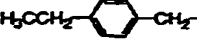
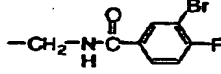
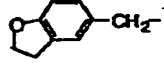
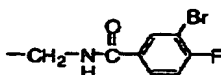
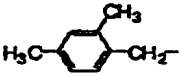
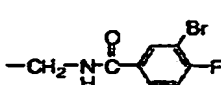
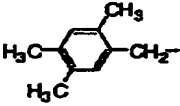
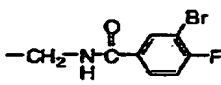

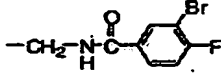

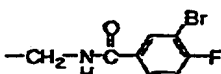
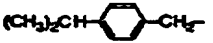
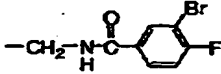

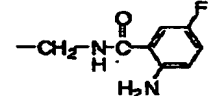

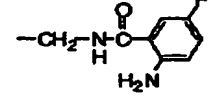

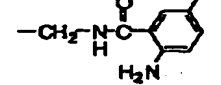
【0278】

Table 1.178

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_j \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
1948		2	2	1	-	H	
1949		2	2	1	-	H	
1950		2	2	1	-	H	
1951		2	2	1	-	H	
1952		2	2	1	-	H	
1953		2	2	1	-	H	
1954		2	2	1	-	H	
1955		2	2	1	-	H	
1956		2	2	1	-	H	
1957		2	2	1	-	H	
1958		2	2	1	-	H	

[0279]

Table 1.179

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{matrix}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
1959		2	2	1	-	H	
1960		2	2	1	-	H	
1961		2	2	1	-	H	
1962		2	2	1	-	H	
1963		2	2	1	-	H	
1964		2	2	1	-	H	
1965		2	2	1	-	H	
1966		2	2	1	-	H	
1967		2	2	1	-	H	
1968		2	2	1	-	H	
1969		2	2	1	-	H	


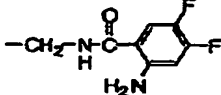

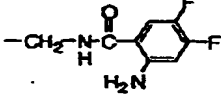
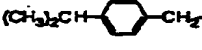
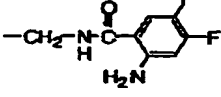
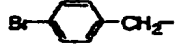
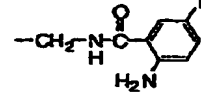

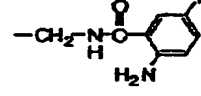
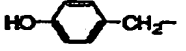
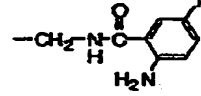
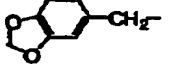
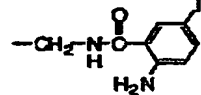
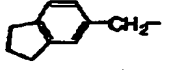
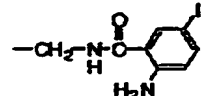

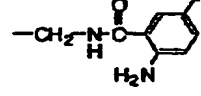
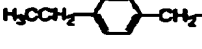
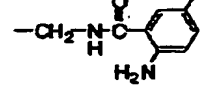
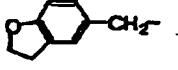
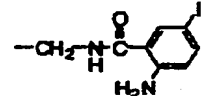
【0280】

Table 1.180

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j -$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1970		2	2	1	-	H	
1971		2	2	1	-	H	
1972		2	2	1	-	H	
1973		2	2	1	-	H	
1974		2	2	1	-	H	
1975		2	2	1	-	H	
1976		2	2	1	-	H	
1977		2	2	1	-	H	
1978		2	2	1	-	H	
1979		2	2	1	-	H	
1980		2	2	1	-	H	

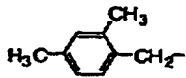
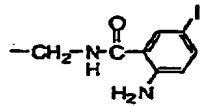

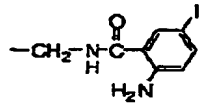

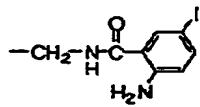
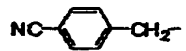
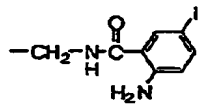
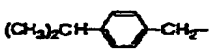
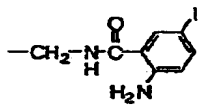
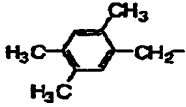
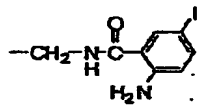
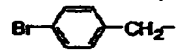
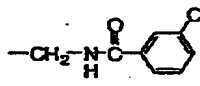

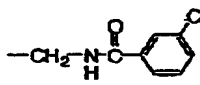

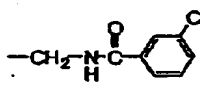
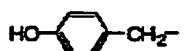
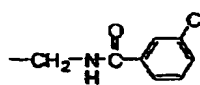
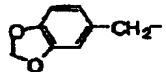
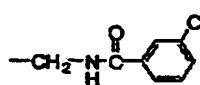
[0281]

Table 1.181

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
1981		2	2	1	-	H	
1982		2	2	1	-	H	
1983		2	2	1	-	H	
1984		2	2	1	-	H	
1985		2	2	1	-	H	
1986		2	2	1	-	H	
1987		2	2	1	-	H	
1988		2	2	1	-	H	
1989		2	2	1	-	H	
1990		2	2	1	-	H	
1991		2	2	1	-	H	

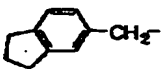
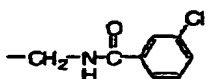

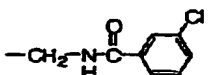
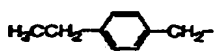
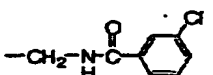
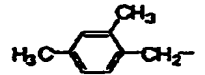
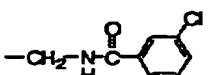

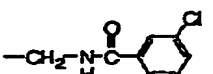

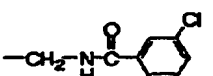

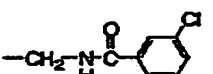
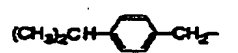
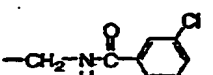
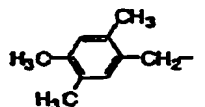
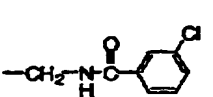
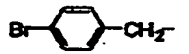
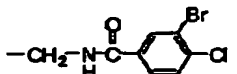

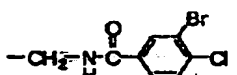
[0 2 8 2]

Table 1.182

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
1992		2	2	1	-	H	
1993		2	2	1	-	H	
1994		2	2	1	-	H	
1995		2	2	1	-	H	
1996		2	2	1	-	H	
1997		2	2	1	-	H	
1998		2	2	1	-	H	
1999		2	2	1	-	H	
2000		2	2	1	-	H	
2001		2	2	1	-	H	
2002		2	2	1	-	H	


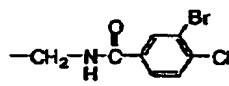
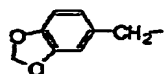
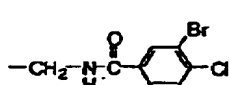
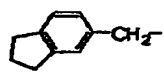
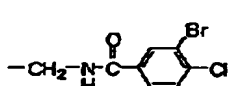

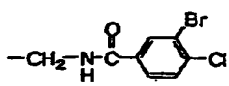
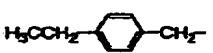
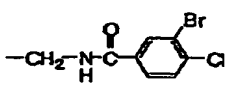
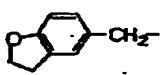
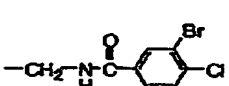
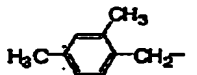
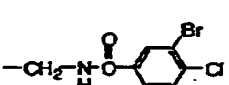

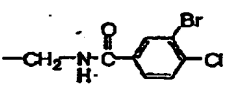

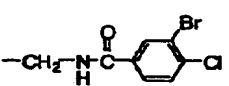
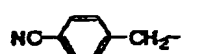
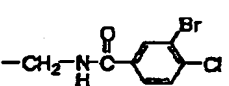
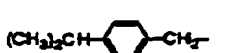
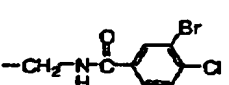
【0283】

Table 1.183

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_i$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
2003		2	2	1	-	H	
2004		2	2	1	-	H	
2005		2	2	1	-	H	
2006		2	2	1	-	H	
2007		2	2	1	-	H	
2008		2	2	1	-	H	
2009		2	2	1	-	H	
2010		2	2	1	-	H	
2011		2	2	1	-	H	
2012		2	2	1	-	H	
2013		2	2	1	-	H	

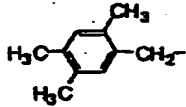
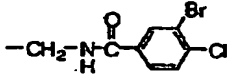
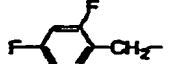
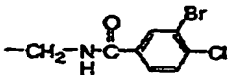

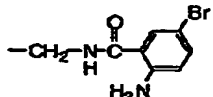

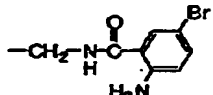

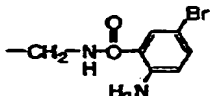
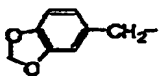
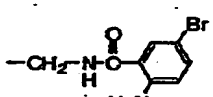
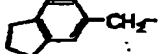
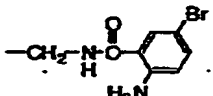

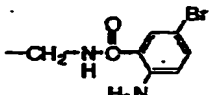
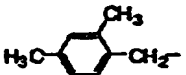
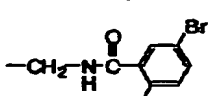

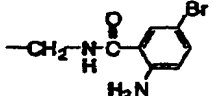

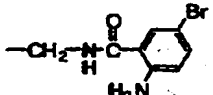
[0284]

Table 1.184

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2014		2	2	1	-	H	
2015		2	2	1	-	H	
2016		2	2	1	-	H	
2017		2	2	1	-	H	
2018		2	2	1	-	H	
2019		2	2	1	-	H	
2020		2	2	1	-	H	
2021		2	2	1	-	H	
2022		2	2	1	-	H	
2023		2	2	1	-	H	
2024		2	2	1	-	H	


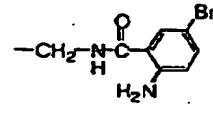
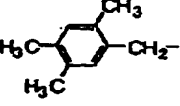
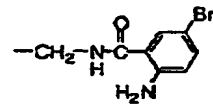
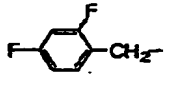
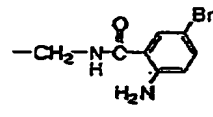
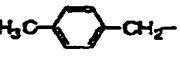
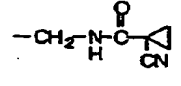
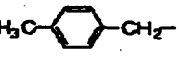
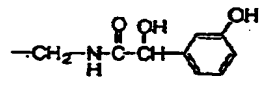
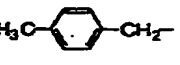
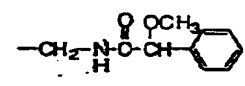
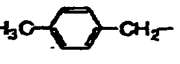
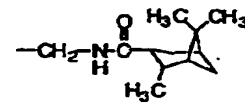
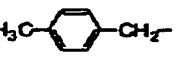
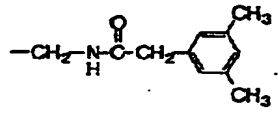
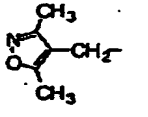
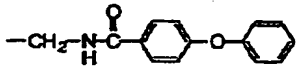
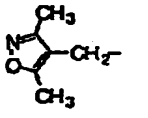
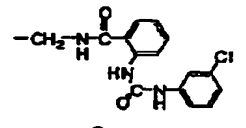
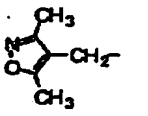
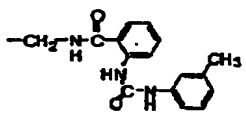
[0285]

Tabl 1.185

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p-\begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array}-(CH_2)_q-G-R^6$
2025		2	2	1	-	H	
2026		2	2	1	-	H	
2027		2	2	1	-	H	
2028		2	2	1	-	H	
2029		2	2	1	-	H	
2030		2	2	1	-	H	
2031		2	2	1	-	H	
2032		2	2	1	-	H	
2033		2	2	1	-	H	
2034		2	2	1	-	H	
2035		2	2	1	-	H	

[0286]

Table 1.186

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_l \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} G \text{---} R^6$
2036		2	2	1	-	H	
2037		2	2	1	-	H	
2038		2	2	1	-	H	
2039		2	2	1	-	H	
2040		1	2	0	R	H	
2041		1	2	0	R	H	
2042		1	2	0	R	H	
2043		1	2	0	R	H	
2044		1	2	0	R	H	
2045		1	2	0	R	H	
2046		1	2	0	R	H	

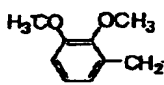
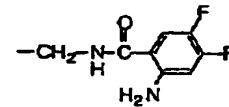
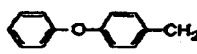
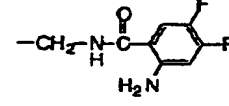
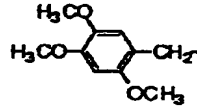
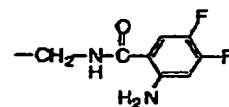
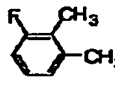
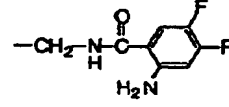
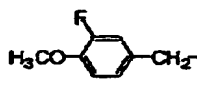
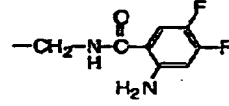
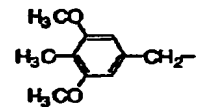
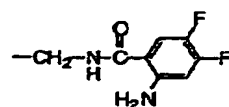
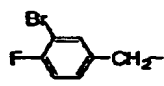
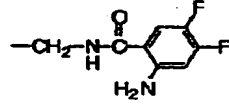
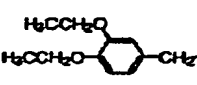
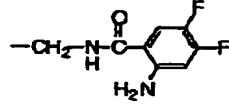
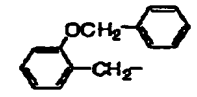
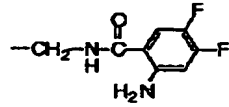
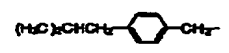
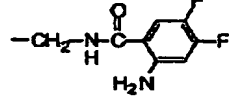
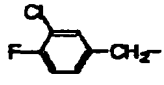
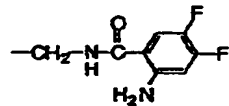
[0287]

Table 1.187

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2047		1	2	0	R	H	
2048		1	2	0	R	H	
2049		1	2	0	R	H	
2050		1	2	0	R	H	
2051		1	2	0	R	H	
2052		2	2	1	-	H	
2053		2	2	1	-	H	
2054		2	2	1	-	H	
2055		2	2	1	-	H	
2056		2	2	1	-	H	
2057		2	2	1	-	H	

[0 2 8 8]

Table 1.188

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2058		2	2	1	-	H	
2059		2	2	1	-	H	
2060		2	2	1	-	H	
2061		2	2	1	-	H	
2062		2	2	1	-	H	
2063		2	2	1	-	H	
2064		2	2	1	-	H	
2065		2	2	1	-	H	
2066		2	2	1	-	H	
2067		2	2	1	-	H	
2068		2	2	1	-	H	

[0 2 8 9]

Table 1.189

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2069		2	2	1	-	H	
2070		2	2	1	-	H	
2071		2	2	1	-	H	
2072		2	2	1	-	H	
2073		2	2	1	-	H	
2074		2	2	1	-	H	
2075		2	2	1	-	H	
2076		2	2	1	-	H	
2077		2	2	1	-	H	
2078		2	2	1	-	H	
2079		2	2	1	-	H	


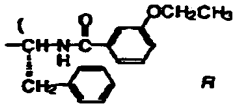

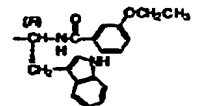

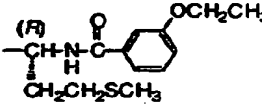

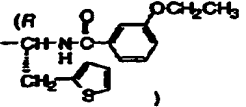

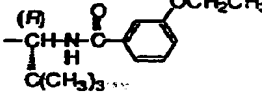

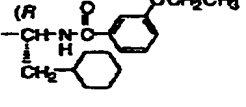

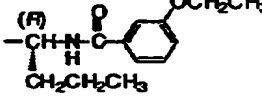

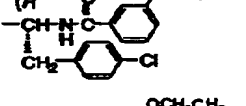

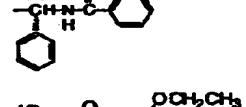

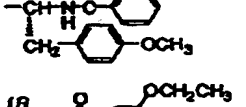

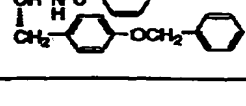
[0290]

Table 1.190

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_k$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2080		2	2	1	-	H	
2081		2	2	1	-	H	
2082		2	2	1	-	H	
2083		1	2	0	R	H	
2084		1	2	0	R	H	
2085		1	2	0	R	H	
2086		1	2	0	R	H	
2087		1	2	0	R	H	
2088		1	2	0	R	H	
2089		1	2	0	R	H	
2090		1	2	0	R	H	


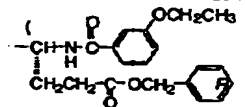

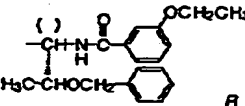

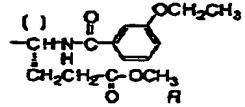
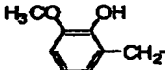
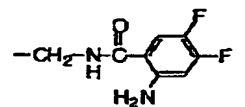
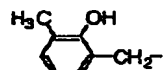
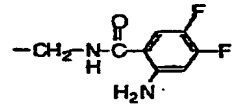
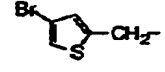
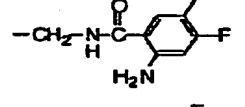
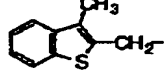
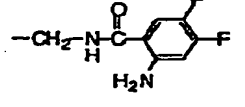
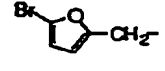
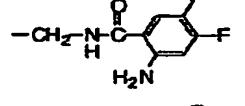
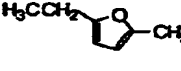
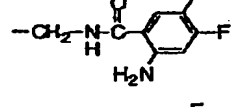
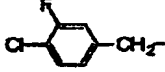
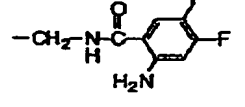
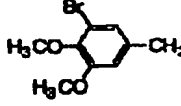
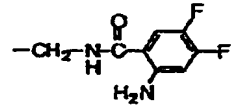
[0 2 9 1]

Table 1.191

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2091		2	2	1	-	H	
2092		2	2	1	-	H	
2093		2	2	1	-	H	
2094		2	2	1	-	H	
2095		2	2	1	-	H	
2096		2	2	1	-	H	
2097		2	2	1	-	H	
2098		2	2	1	-	H	
2099		2	2	1	-	H	
2100		2	2	1	-	H	
2101		2	2	1	-	H	

[0292]

Tabl 1.192

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{matrix} (CH_2)_j$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{matrix} R^4 \\ \\ R^5 \end{matrix} (CH_2)_q - G - R^6$
2102		2	2	1	-	H	
2103		2	2	1	-	H	
2104		2	2	1	-	H	
2105		2	2	1	-	H	
2106		2	2	1	-	H	
2107		2	2	1	-	H	
2108		2	2	1	-	H	
2109		2	2	1	-	H	
2110		2	2	1	-	H	
2111		2	2	1	-	H	
2112		2	2	1	-	H	

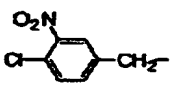
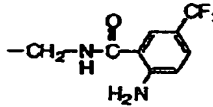
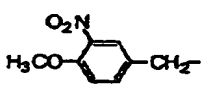
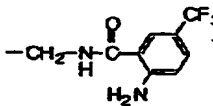
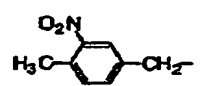
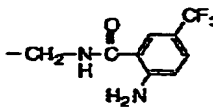
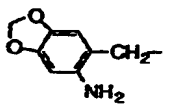
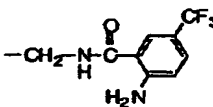
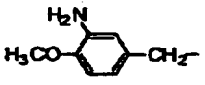
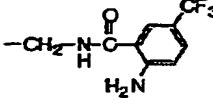
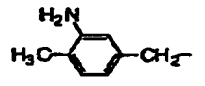
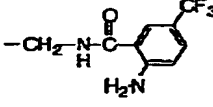
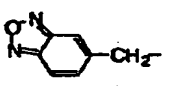
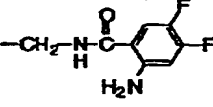
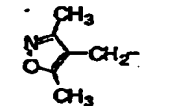
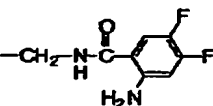
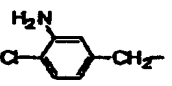
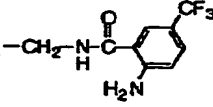
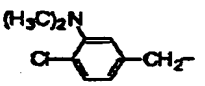
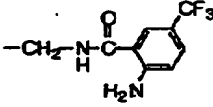
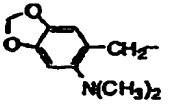
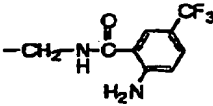
[0293]

Tabl 1.193

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2113		2	2	1	-	H	
2114		2	2	1	-	H	
2115		2	2	1	-	H	
2116		2	2	1	-	H	
2117		2	2	1	-	H	
2118		1	2	0	R	H	
2119		1	2	0	R	H	
2120		1	2	0	R	H	
2121		1	2	0	R	H	
2122		1	2	0	R	H	
2123		1	2	0	R	H	

[0 2 9 4]

Table 1.194

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
2124		1	2	0	R	H	
2125		1	2	0	R	H	
2126		1	2	0	R	H	
2127		1	2	0	R	H	
2128		1	2	0	R	H	
2129		1	2	0	R	H	
2130		2	2	1	-	H	
2131		2	2	1	-	H	
2132		1	2	0	R	H	
2133		1	2	0	R	H	
2134		1	2	0	R	H	

[0295]

Tabl 1.195

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_j - \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$\begin{array}{c} R^4 \\ \\ -(CH_2)_p - C - (CH_2)_q - G - R^6 \\ \\ R^5 \end{array}$
2135	$\begin{array}{c} (H_3C)_2N \\ \\ H_3CO - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	1	2	0	R	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2136	$\begin{array}{c} (H_3C)_2N \\ \\ H_3C - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	1	2	0	R	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2137	$\begin{array}{c} CH_3 \\ \\ Cl - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	1	2	0	R	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2138	$\begin{array}{c} CH_3 \\ \\ \text{C}_6H_5 - N - C(=O) - CH_2 - \\ \\ CH_3 \end{array}$	1	2	0	R	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2139	$\begin{array}{c} Cl \\ \\ H_3C - N - C(=O) - CH_2 - \\ \\ CH_3 \end{array}$	1	2	0	R	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2140	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{O} - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \\ \\ NH_2 \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} F \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2141	$\begin{array}{c} H_2N \\ \\ HO - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} F \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2142	$\begin{array}{c} H_2N \\ \\ Cl - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} F \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2143	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{O} - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \\ \\ HN - C(=O) - CH_3 \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} F \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2144	$\begin{array}{c} H_2N \\ \\ H_3CO - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$
2145	$\begin{array}{c} H_2N \\ \\ HO - \text{C}_6H_4 - CH_2 - \end{array}$	2	2	1	-	H	$\begin{array}{c} \text{CF}_3 \\ \\ -CH_2 - NH - C(=O) - \text{C}_6H_4 - NH_2 \\ \\ H \end{array}$

[0 2 9 6]

Tabl 1.196

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_l - \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
2146		2	2	1	-	H	
2147		2	2	1	-	H	
2148		2	2	1	-	H	
2149		1	2	0	R	H	
2150		1	2	0	R	H	
2151		1	2	0	R	H	
2152		1	2	0	R	H	
2153		1	2	0	R	H	
2154		2	2	1	-	H	
2155		2	2	1	-	H	
2156		2	2	1	-	H	

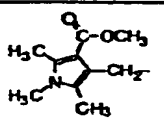
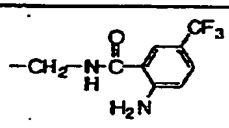
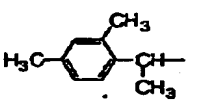
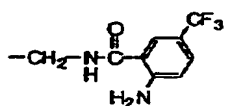
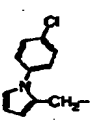
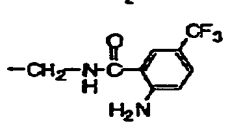
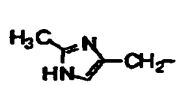
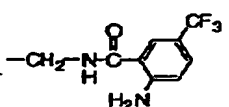
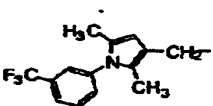
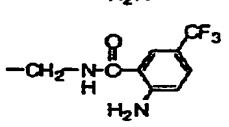
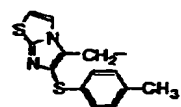
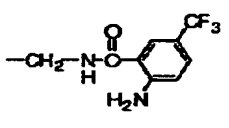
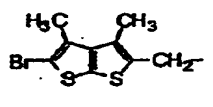
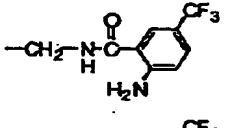
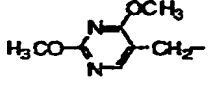
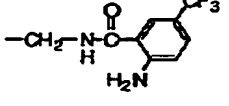
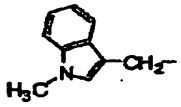
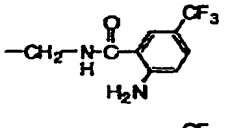
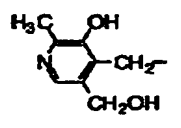
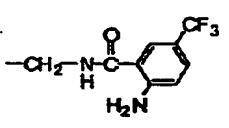
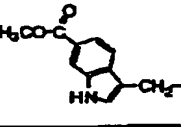
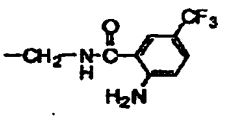
【0297】

Tabl 1.197

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_k \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2157		1	2	0	R	H	
2158		1	2	0	R	H	
2159		2	2	1	-	H	
2160		2	2	1	-	H	
2161		2	2	1	-	H	
2162		2	2	1	-	H	
2163		2	2	1	-	H	
2164		1	2	0	R	H	
2165		1	2	0	R	H	
2166		1	2	0	R	H	
2167		1	2	0	R	H	

[0298]

Table 1.198

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ R^2 \end{array} (CH_2)_l$	k	m	n	chirality	R^3	$-(CH_2)_p \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} (CH_2)_q - G - R^6$
2168		1	2	0	R	H	
2169		1	2	0	R	H	
2170		1	2	0	R	H	
2171		1	2	0	R	H	
2172		1	2	0	R	H	
2173		1	2	0	R	H	
2174		1	2	0	R	H	
2175		1	2	0	R	H	
2176		1	2	0	R	H	
2177		1	2	0	R	H	
2178		1	2	0	R	H	

[0299]

Table 1.199

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \diagup \\ (CH_2)_j \\ \diagdown \\ R^2 \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p-\overset{\overset{R^4}{ }}{\underset{\underset{R^5}{ }}{C}}-(CH_2)_q-G-R^6$
2179		1	2	0	R	H	
2180		1	2	0	R	H	
2181		1	2	0	R	H	
2182		1	2	0	R	H	
2183		1	2	0	R	H	
2184		2	2	1	-	H	
2185		2	2	1	-	H	
2186		2	2	1	-	H	
2187		1	2	0	R	H	
2188		2	2	1	-	H	
2189		1	2	0	R	H	

[0300]

Table 1.200

Compd. No.	$\begin{array}{c} R^1 \\ \\ R^2 - (CH_2)_k - \end{array}$	k	m	n	chirality	R ³	$-(CH_2)_p - \begin{array}{c} R^4 \\ \\ R^5 \end{array} - (CH_2)_q - G - R^6$
2190		2	2	1	-	H	
2191		2	2	1	-	H	
2192		2	2	1	-	H	
2193		2	2	1	-	H	
2194		2	2	1	-	H	
2195		2	2	1	-	H	
2196		1	2	0	R	H	
2197		1	2	0	R	H	
2198		1	2	0	R	H	
2199		2	2	1	-	H	
2200		2	2	1	-	H	

【0301】

Table 1.201

Compd. No.	$\begin{matrix} R^1 \\ R^2 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_k \text{---}$	k	m	n	chirality	R^3	$\text{---} (\text{CH}_2)_p \text{---} \begin{matrix} R^4 \\ R^5 \end{matrix} \text{---} (\text{CH}_2)_q \text{---} \text{G---} R^6$
2201		2	2	1	-	H	
2202		1	2	0	R	H	
2203		2	2	1	-	H	
2204		2	2	1	-	H	
2205		2	2	1	-	H	
2206		2	2	1	-	H	
2207		2	2	1	-	H	
2208		2	2	1	-	H	
2209		2	2	1	-	H	

【0302】

本発明においては、環状アミン化合物の酸付加体も用いられる。かかる酸として、例えば塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、炭酸などの鉱酸；マレイン酸、ク

エン酸、リンゴ酸、酒石酸、フマル酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、蟻酸などの有機酸が挙げられる。

【0303】

さらに、本発明においては、例えばヨウ化 1 - (4 - クロロベンジル) - 1 - メチル - 4 - [{ N - (3 - トリフルオロメチルベンゾイル) グリシル } アミノメチル] ピペリジニウムのような、環状アミン化合物の C₁ ~ C₆ アルキル付加体も用いられる。ここで、アルキル基としては、例えばメチル、エチル、n - プロピル、n - ブチル、n - ペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル、n - オクチル、イソプロピル、イソブチル、sec - ブチル、tert - ブチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert - ペンチル、2 - メチルペンチル、1 - エチルブチル基が好適な具体例として挙げられるが、特に好ましい例としては、メチル基、エチル基などが挙げられる。また、アンモニウム陽イオンの対陰イオンの好適な具体例としては、フッ化物、塩化物、臭化物、またはヨウ化物などのハロゲン化物陰イオンを挙げることができる。

【0304】

本発明においては、上記式 (I) で表わされる化合物のラセミ体、および可能なすべての光学活性体も用いることができる。

【0305】

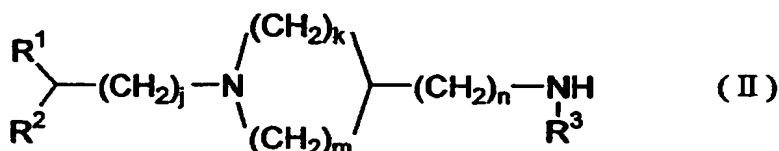
上記式 (I) で表わされる化合物は、国際公開 WO 9 9 2 5 6 8 6 号パンフレットに記載されているように、下記に示すいずれかの一般的な製造法を用いることにより合成可能である。

(製造法 1)

下記式 (II)

【0306】

【化 3】



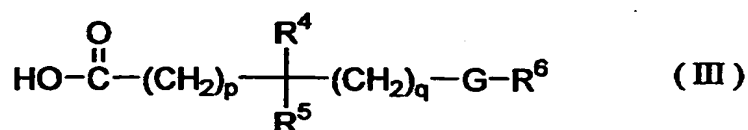
【0307】

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、j、k、m、およびnは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表わされる化合物1当量と、下記式(III)

【0308】

【化4】



【0309】

[式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 、G、p、およびqは、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表わされるカルボン酸、またはその反応性誘導体の0.1～10当量を実溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

【0310】

上記式(III)で表わされるカルボン酸の「反応性誘導体」とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの合成有機化学分野において通常使用される反応性の高いカルボン酸誘導体を意味する。

【0311】

かかる反応は、適当量のモレキュラーシーブなどの脱水剤；ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、N-エチル-N-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDCIまたはWSC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、N-ヒドロキシサクシンイミド(HOSu)、N-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBT)、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリス(ピロリジノール)ホスホニウム=ヘキサフルオロホスフェート(PyBOP)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウム=ヘキサフルオロホスフェート(HBTU)、2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)-1,1,3,3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボ

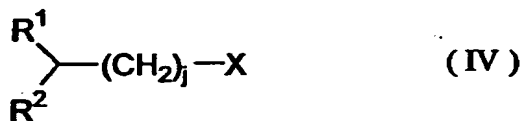
レート (TBTU)、2-(5-ノルボルネン-2, 3-ジカルボキシイミド)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボレート (TNTU)、O-(N-サクシニミジル)-1, 1, 3, 3-テトラメチルウロニウム=テトラフルオロボレート (TSTU)、プロモトリス (ピロリジノ) ホスホニウム=ヘキサフルオロホスフェート (PyBroP) などの縮合剤；炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジンなどのアミン類、(ピペリジノメチル) ポリスチレン、(モルホリノメチル) ポリスチレン、(ジメチルアミノメチル) ポリスチレン、ポリ(4-ビニルピリジン) などの高分子支持塩基などの塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

(製造法2)

下記式 (IV)

【0312】

【化5】



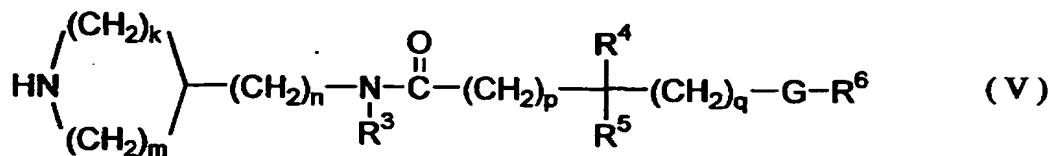
【0313】

[式中、 R^1 、 R^2 、および j は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、 X はハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、またはアリールスルホニルオキシ基を表わす。]

で表わされるアルキル化試薬 1 当量と、下記式 (V)

【0314】

【化 6】



【0315】

[式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 k 、 m 、 n 、 p 、および q は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表わされる化合物0.1~10当量が無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

【0316】

かかる反応は、上記製造法1と同様の塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。さらに、本製造方法において、ヨウ化カリウム、ヨウ化ナトリウムなどのヨウ化物を共存させることにより、反応を促進できる場合がある。

【0317】

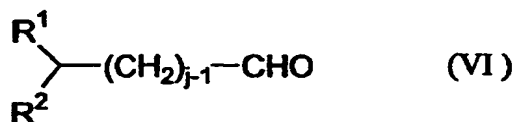
上記式(IV)において、 X はハロゲン原子、アルキルスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基を表わす。かかるハロゲン原子としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が好ましく挙げられる。アルキルスルホニルオキシ基の好適な具体例としては、メチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基などが挙げられる。アリールスルホニルオキシ基の好適な具体例としては、トシルオキシ基を挙げることができる。

(製造法3)

下記式(VI)

【0318】

【化 7】



【0319】

[式中、 R^1 および R^2 は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、 j は 1 または 2 を表わす。]

または、下記式 (VII)



[式中、 R^1 は、上記式 (I) における R^1 の定義と同じであり、 j は 0 を表わす場合に相当する。]

で表わされるアルデヒド 1 当量と、上記式 (V) で表わされる化合物 0. 1 ~ 1.0 当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

【0320】

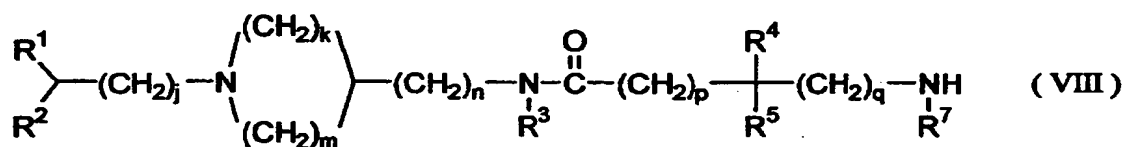
かかる反応は、一般に還元的アミノ化反応と呼ばれ、還元条件としては、パラジウム、白金、ニッケル、ロジウムなど金属を含む触媒を用いる接触水素添加反応、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムなどの複合水素化物およびボランを用いる水素化反応、または電解還元反応などを用いることができる。

(製造法 4)

下記式 (VIII)

【0321】

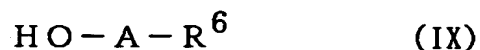
【化 8】



【0322】

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 j 、 k 、 m 、 n 、 p 、および q は、上記式(I)におけるそれぞれの定義と同じである。]

で表わされる化合物1当量と、下記式(IX)



[式中、 R^6 は、上記式(I)における R^6 の定義と同じであり、 A はカルボニル基またはスルホニル基を表わす。]

で表わされるカルボン酸またはスルホン酸、またはそれらの反応性誘導体0.1～10当量を、無溶媒下、または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

【0323】

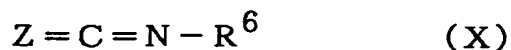
上記式(IX)で表わされるカルボン酸またはスルホン酸の反応性誘導体とは、例えば酸ハロゲン化物、酸無水物、混合酸無水物などの、合成有機化学分野で一般に使用される反応性の高いカルボン酸またはスルホン酸誘導体を意味する。

【0324】

かかる反応は、上記製造法1と同様の脱水剤、縮合剤、または塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

(製造法5)

上記式(VIII)で表わされる化合物1当量と、下記式(X)



[式中、 R^6 は上記式(I)における R^6 の定義と同じであり、 Z は酸素原子または硫黄原子を表わす。]

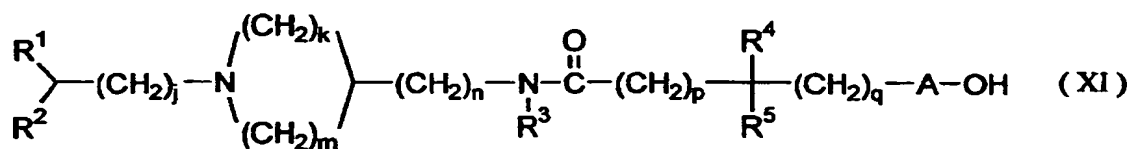
で表わされるイソシアネートまたはイソチオシアネート0.1～10当量を、無溶媒下または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

(製造法6)

下記式(XI)

【0325】

【化 9】



【0 3 2 6】

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 j 、 k 、 m 、 n 、 p 、および q は、上記式 (I) におけるそれぞれの定義と同じであり、 A はカルボニル基またはスルホニル基を表わす。]

で表わされる化合物 1 当量と、下記式 (XII)



[式中、 R^6 は、上記式 (I) における R^6 の定義と同じである。]

で表わされるアミン 0. 1 ~ 1 0 当量を、無溶媒下または溶媒存在下に反応させることによる製造方法。

【0 3 2 7】

かかる反応は、上記製造法 1 と同様の脱水剤、縮合剤、または塩基を適宜用いることにより、より円滑に進行させることができる。

【0 3 2 8】

上記製造法 1 ~ 6 において、各反応に供する基質が、一般に有機合成化学において各反応条件において反応するか、あるいは反応に悪影響を及ぼすことが考えられる置換基を有する場合には、その官能基を既知の適当な保護基で保護して反応に供した後、従来既知の方法を用いて脱保護することにより、目的の化合物を得ることができる。

【0 3 2 9】

さらに、本発明で用いられる化合物は、例えばアルキル化反応、アシル化反応、還元反応などの、一般に有機合成化学において使用される既知の反応を用いて、上記製造法 6 により製造される化合物の (単数または複数の) 置換基をさらに変換することによっても得ることができる。

【0 3 3 0】

上記各製造法において、反応溶媒としてはジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル類、酢酸エチルなどのエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルなどの非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類などが、反応に応じて適宜用いられる。

【0331】

いずれの製造方法においても、反応温度は -78°C ～ $+150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは 0°C ～ 100°C の範囲である。反応完了後、通常の単離、精製操作、すなわち濃縮、濾過、抽出、固相抽出、再結晶、クロマトグラフィーなどを行うことにより、目的とする上記式(I)で表わされる環状アミン化合物を単離することができる。また、それらは通常の方法により、薬学的に許容される酸付加体または C_1 ～ C_6 アルキル付加体に変換することができる。

【0332】

【実施例】

本発明を以下、実施例に基づいて説明する。しかしながら、本発明はこれらの実施例に記載された化合物に限定されるものではない。以下の実施例において各化合物に付された化合物番号(Compd. No.)は、Table 1. 1～1. 201において好適な具体例として挙げた化合物に付された化合物番号(Compd. No.)と対応している。

【0333】

【参考例1】 (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン(化合物番号69)の合成

本発明の化合物はWO9925686号パンフレット記載の製造法により合成したが、例えば化合物番号69の(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジンは以下のように合成した。

【0334】

1) 3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩

4-クロロベンジルクロリド (4.15 g, 25.8 mmol) と $i\text{Pr}_2\text{NEt}$ (6.67 g, 51.6 mmol) を、3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}ピロリジン (4.81 g, 25.8 mmol) の DMF 溶液 (50 mL) に加えた。反応混合物を 70℃ で 15 時間攪拌し、溶媒を減圧下に除去した。再結晶 (CH_3CN , 50 mL) により目的とする 3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン (6.43 g, 80%) を黄白色固体として得た: ^1H NMR (CDCl_3 , 300 MHz) δ 1.37 (s, 9 H), 1.5-1.7 (br, 1 H), 2.1-2.4 (m, 2 H), 2.5-2.7 (m, 2 H), 2.83 (br, 1 H), 3.57 (s, 2 H), 4.1-4.3 (br, 1 H), 4.9-5.1 (br, 1 H), 7.15-7.35 (br, 4 H); 純度は RPLC/MS で求めた (98%); ESI/MS m/e 311.0 ($\text{M}^+\text{+H}$, $\text{C}_{16}\text{H}_{24}\text{ClN}_2\text{O}_2$)

3-{(tert-ブトキシカルボニル)アミノ}-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン (6.38 g, 20.5 mmol) の CH_3OH (80 mL) 溶液に 1N $\text{HCl-Et}_2\text{O}$ (100 mL) を加え、25℃ で 15 時間攪拌した。溶媒を減圧下に除去し、固体を得、再結晶 (1:2 $\text{CH}_3\text{OH-CH}_3\text{CN}$, 130 mL) で精製することにより、3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩 (4.939 g, 85%) を白色粉末として得た: ^1H NMR ($d_6\text{-DMSO}$, 300 MHz) δ 3.15 (br, 1 H), 3.3-3.75 (br-m, 4 H), 3.9 (br, 1 H), 4.05 (br, 1 H), 4.44 (br, 1 H), 4.54 (br, 1 H), 7.5-7.7 (m, 4 H), 8.45 (br, 1 H), 8.60 (br, 1 H); 純度は RPLC/MS で求めた (>99%); ESI/MS m/e 211.0 ($\text{M}^+\text{+H}$, $\text{C}_{11}\text{H}_{16}\text{ClN}_2$)

光学活性 (R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩と (S)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩を、それぞれ対応する原料を用いて上記の方法により合成した。生成物は、上記ラセミ体と同じ ^1H NMR を示した。

【0335】

2) (R)-3-{(N-tert-ブトキシカルボニル)グリシル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン

(R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン・二塩酸塩 (4

54 g, 16.0 mmol)、2N NaOH溶液(80 mL)、および、酢酸エチル(80 mL)の混合物を攪拌し、有機層を分離し、水層を酢酸エチル(80 mL x 2)で抽出した。有機層をあわせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮することにより遊離の(R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.35 g, 99%)を得た。

【0336】

(R)-3-アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.35 g, 16 mmol)のCH₂Cl₂(80 mL)溶液に、Et₃N(2.5 mL, 17.6 mmol)、N-tert-ブトキシカルボニルグリシン(2.79 g, 16.0 mmol)、EDCI(3.07 g, 16.0 mmol)およびHOBT(12.16 g, 16 mmol)を加えた。反応混合物を25℃で16時間攪拌した後、2N NaOH溶液(80 mL)を加えた。有機層を分離し、水層をジクロロメタンで抽出した(100 mL x 3)。有機層をあわせて水(100 mL x 2)と食塩水(100 mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾過、濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO₂, 酢酸エチル)により、目的とする(R)-3-{N-(tert-ブトキシカルボニル)グリシル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(5.40 g, 92%)を得た。

【0337】

3) (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-(グリシルアミノ)ピロリジンの合成

(R)-3-{N-(tert-ブトキシカルボニル)グリシル}アミノ-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(5.39 g, 14.7 mmol)のメタノール(60 mL)溶液に、4N HClジオキサン(38 mL)溶液を加えた。この溶液を室温で2時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、2N NaOH溶液(80 mL)を加えた。混合液をジクロロメタン(80 mL x 3)で抽出し、抽出液をあわせて無水硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO₂, AcOEt/EtOH/Et₃N=90/5/5)により、(R)-3-(グリシルアミノ)-1-(4-クロロベンジル)ピロリジン(3.374 g, 86%)を得た：¹H NMR(CDCl₃, 270 MHz) δ 1.77 (dd, J = 1.3および

6.9 Hz, 1 H), 2.20-3.39 (m, 2 H), 2.53 (dd, $J = 3.3$ および 9.6 Hz, 1 H), 2.62 (dd, $J = 6.6$ および 9.6 Hz, 1 H), 2.78-2.87 (m, 1 H), 3.31 (s, 2 H), 3.57 (s, 2 H), 4.38-4.53 (br, 1 H), 7.18-7.32 (m, 4 H), 7.39 (br, s, 1 H)

4) (R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン (化合物番号69)

3,4-ジフルオロベンゾイルクロリド (0.060 mmol) のクロロホルム溶液 (0.4 mL) を、(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-(グリシルアミノ)ピロリジン (0.050 mmol) とトリエチルアミン (0.070 mmol) のクロロホルム (1.0 mL) 溶液に加えた。この反応混合物を室温で2.5時間攪拌した後、(アミノメチル)ポリスチレン樹脂 (1.04 mmol/g, 50 mg, 50 mmol) を加え、混合物を室温で12時間攪拌した。反応混合物を濾過し、樹脂をジクロロメタン (0.5 mL) で洗浄した。濾液と洗液とを合わせ、ジクロロメタン (4 mL) を加え、溶液を2N NaOH水溶液 (0.5 mL) にて洗浄し、濃縮することにより、(R)-1-(4-クロロベンジル)-3-[{N-(3,4-ジフルオロベンゾイル)グリシル}アミノ]ピロリジン (化合物番号69) を得た (7.8 mg, 38%) : 純度はRPLC/MSで求めた (>99%) ; ESI/MS m/e 408.0 ($M^+ + H$, $C_{20}H_{20}ClF_2N_3O_2$)

【実施例1】エオタキシンにより惹起されるCCR3発現細胞の細胞内カルシウム濃度上昇に対する被験化合物の阻害能の測定

CCR3レセプターを安定して発現するK562細胞を用いて、細胞内カルシウム濃度上昇に対する本発明による化合物の阻害能を次の方法にて測定した。

【0338】

CCR3発現K562細胞を10 mM HEPES含有HBSS溶液に懸濁したものに1 mM Fura2アセトキシメチルエステル (同仁化学社製) を加え、37℃にて30分間インキュベートした。これを340 nmと380 nmで励起し、340/380比をモニターすることにより、細胞内カルシウム濃度を測定した。アゴニストとしてヒトエオタキシン (0.5 μ g/mL) を用い、被験化合物の阻害能はエオタキシンで刺激する5分前にCCR3発現K562細胞を被験化合物で処理したときの細胞内カルシウム濃度を測定し、下記の式により抑

制率 (%) を算出した。

【0339】

$$\text{抑制率 (\%)} = \{1 - (A - B) / (C - B)\} \times 100$$

(A : 被験化合物で処理した後エオタキシンで刺激したときの細胞内カルシウム濃度、B : 無刺激のときの細胞内カルシウム濃度、C : 被験化合物で処理せずにエオタキシンで刺激したときの細胞内カルシウム濃度)

本発明で用いる環状アミン誘導体の阻害能を測定したところ、例えば、下記の化合物は、10 μ M の濃度において、それぞれ 20 ~ 50 %、50 % ~ 80 %、および、> 80 % の阻害能を示した。

【0340】

10 μ M の濃度において 20 % ~ 50 % の阻害能を示した化合物：

化合物番号 11, 156, 234, 330, 392, 424, 481, 523, 525, 533, 558, 567, 582, 602, 613, 630, 646, 649, 701, 738, 741, 754, 767, 814, 816, 833, 839, 873, 902, 909, 945, 1002, 1159, 1170, 1258, 1315, 1352, 1357, 1407, 1417, 1448, 1472, 1504, 1508, 1531, 1558, 1562, 1569, 1661, 1670, 1686, 1719, 1751, 1756, 1769, 1775, 1783, 1797, 1802, 1803, 1815, 1834, 1841, 1846, 1883, 1887, 1889, 1892, 1913, 1924, 1928, 1960, 2006, 2013, 2035, 2052, 2083, 2113, 2127, 2136, 2189

10 μ M の濃度において 50 % ~ 80 % の阻害能を示した化合物：

化合物番号 83, 115, 146, 150, 216, 294, 297, 322, 405, 440, 459, 461, 466, 482, 484, 487, 490, 492, 503, 526, 528, 550, 562, 570, 578, 620, 623, 659, 685, 687, 703, 716, 730, 733, 755, 770, 850, 856, 867, 876, 998, 1015, 1024, 1223, 1259, 1267, 1295, 1377, 1402, 1412, 142

0, 1485, 1519, 1550, 1560, 1595, 1601, 1650, 1701, 1725, 1754, 1836, 1856, 1870, 1912, 1923, 1929, 2095, 2120, 2138, 2179

10 μ Mの濃度において>80%の阻害能を示した化合物:

化合物番号7, 32, 68, 169, 173, 203, 209, 215, 520, 544, 547, 851, 852, 855, 874, 910, 1003, 1012, 1032, 1038, 1042, 1043, 1046, 1114, 1190, 1244, 1247, 1384, 1441, 1513, 1527, 1545, 1582, 1673, 1687, 1689, 1705, 1850, 1869, 1871, 1876, 1877, 1899, 2027

【実施例2】 CCR3発現細胞膜画分へのエオタキシンの結合に対する阻害能の測定

ヒトCCR3発現K562細胞より調製した細胞膜画分を0.5mg/mLになるようにアッセイバッファー(25mM HEPES、pH7.6、1mM CaCl_2 、5mM MgCl_2 、0.5%BSA)に懸濁し膜画分懸濁液とした。被験化合物をアッセイバッファーで希釈した溶液を被験化合物溶液とした。 [^{125}I] 標識ヒトエオタキシン(アマシャム社製)を1 μCi /mLになるようにアッセイバッファーで希釈した溶液を標識リガンド溶液とした。0.5%BSAで被覆した96ウェルマイクロプレートに、1ウェルあたり被験化合物溶液25 μL 、標識リガンド溶液25 μL 、膜画分懸濁液50 μL の順番に分注し攪拌後(反応溶液100 μL)、25℃で90分インキュベートした。

【0341】

反応終了後、あらかじめ0.5%ポリエチレンイミン溶液にフィルターを浸漬した96ウェルフィルタープレート(ミリポア社製)で反応液をフィルター濾過し、フィルターを冷洗浄バッファー(アッセイバッファー+0.5M NaCl)150 μL で4回洗浄した(冷洗浄バッファー150 μL を加えた後、濾過)。フィルターを風乾後、液体シンチレーターを1ウェルあたり25 μL ずつ加え、フィルター上の膜画分が保持する放射能をトップカウント(パッカード社製)にて測定した。

【0342】

被験化合物の代わりに非標識ヒトエオタキシン 100 ng を添加した時のカウントを非特異的吸着として差し引き、被験化合物を何も添加しない時のカウントを100%として、ヒトエオタキシンのCCR3膜画分への結合に対する被験化合物の阻害能を算出した。

【0343】

$$\text{阻害率 (\%)} = \{1 - (A - B) / (C - B)\} \times 100$$

(A: 被験化合物添加時のカウント、B: 非標識ヒトエオタキシン 100 ng 添加時のカウント、C: [^{125}I] 標識ヒトエオタキシンのみ添加した時のカウント)

【0344】

【発明の効果】

本発明の環状アミン化合物、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル付加体を有効成分とする薬剤、もしくは、CCR3が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬は、CCR3拮抗剤として、エオタキシンなどのCCR3のリガンドの標的細胞に対する作用を抑制する作用を有するので、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、接触皮膚炎、およびアレルギー性結膜炎などのアレルギー性疾患、ならびに潰瘍性大腸炎およびクローン病などの炎症性腸疾患など、好酸球、好塩基球、活性化T細胞などの組織への浸潤が病気の進行、維持に主要な役割を演じている疾患に対する治療薬および／または予防薬として有用である。また、CCR3拮抗作用に基づくHIV-1の感染を阻害する作用により、エイズの治療薬および／または治療薬としても有用である。

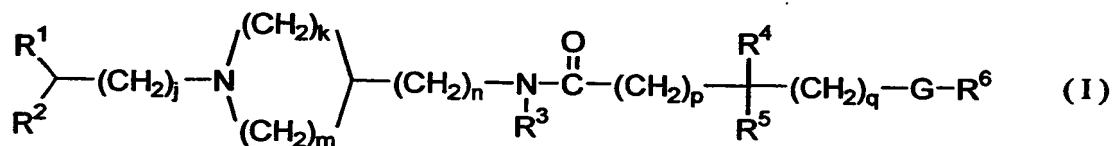
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 CCR3 が関与する疾患の治療薬もしくは予防薬を提供する。

【解決手段】 下記式 (I) で表わされる環状アミン誘導体、その薬学的に許容される酸付加体、またはその薬学的に許容される $C_1 \sim C_6$ アルキル付加体を有効成分として含有する、喘息、アレルギー性鼻炎などの CCR3 が関与する疾患を治療および／または予防する作用を有する医薬。

【化 1】



【選択図】 なし

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[000003001]

1. 変更年月日	1990年 8月28日
[変更理由]	新規登録
住 所	大阪府大阪市中央区南本町1丁目6番7号
氏 名	帝人株式会社